

This Page Is Inserted by IFW Operations
and is not a part of the Official Record

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning documents *will not* correct images,
please do not report the images to the
Image Problem Mailbox.

- For more records, click the Records link at page end.
- To change the format of selected records, select format and click Display Selected.
- To print/save clean copies of selected records from browser click Print/Save Selected.
- To have records sent as hardcopy or via email, click Send Results.

<input checked="" type="checkbox"/> Select All	<input type="checkbox"/> Clear Selections	Print/Save Selected	Send Results	Format
				Display Selected <input checked="" type="checkbox"/> Free <input type="checkbox"/>

1. 1/5/1

001644903

WPI Acc No: 1976-79350X/197643

Hypolipemic carboxylic-amides - such as N-isovaleryl
N,N'-bis-(10-undecenoyl) ethylene-diamine

Patent Assignee: BAYER AG (FARB)

Number of Countries: 011 Number of Patents: 012

Patent Family:

Patent No	Kind	Date	Applicat No	Kind	Date	Week
BE 840469	A	19761007				197643 B
DE 2515146	A	19761021				197644
NL 7603594	A	19761012				197644
NO 7601050	A	19761101				197648
JP 51127002	A	19761105				197651
FI 7600919	A	19761130				197652
DK 7601641	A	19761205				197701
FR 2306683	A	19761209				197706
SE 7602707	A	19770307				197712
PT 64980	A	19770406				197717
ZA 7602088	A	19770301				197719
DE 2551483	A	19770518				197721

Priority Applications (No Type Date): DE 2551483 A 19751117; DE 2515146 A 19750408

Abstract (Basic): BE 840469 A

New carboxamides of formula (I): (where R1-3=same or different, saturated or unsaturated, straight branched or cyclic hydrocarbyl the carbon chain of which may be interrupted by heteroatoms or divalent groups e.g. O, S, -SO-, -SO2-, -CO- or phnylene and may be substituted by substituants such as halo, alkoxy, acyloxy, aryl, aryloxy, arylmercapto, aroyl, alkylmercapto, alkylsulphenyl, alkylsulphonyl, acylamino, aroylamino, cyano, alkoxy carbonyl, aryloxycarbonyl or carbamoyl (opt. subst. by alkyl): R4,R5=same or different H, opt. subst. baryl or saturated or unsaturated, straight, branched or cyclic hydrocarbyl the carbon chain of which is opt. interrupted by heteroatoms or groups such as O, S, SO2, SO, CO and phenylene and may be subst. by hydroxy, alkoxy, halo, acyloxy, acylamino, aryl, aryloxy, aroyl, alkylmercapto, alkylsulphonyl, alkylsulphiny, cyano, alkoxy carbonyl, aryloxycarbonyl or carbamou (opt. subst. by alkyl or aryl) radicals or R4 and R5 together may form an alkylene chain; when n=0, R4 and R5 together = alkylene thus form a heterocyclic containing the two N atoms: X=saturated or unsaturated, straigh, branched or cyclic hydrocarbon chain which may be interrupted by heteroatoms or groups such as O, S, SO, SO2, arylaza, alkylaza, carbonyl or phenylene and may be subst. by halo, alkoxy, aryloxy, hydroxy, cyano, carboxy, carbalkoxy, acylamino, carbaryloxy, alkylmercapto, alkylsulphonyl, alkylsulphonyl, arylmercapto, aryl or carbamoyl (opt. subst. by alkyl or aryl), radicals and n=0-4. All aryl radicals defined in R1-5 and X have 6-10C atoms and are opt. subst. (I) are hypolipemics which reduce hyperlipemia and the absorption of cholesterol and is administered orally, parenthely or rectally in the treatment of lipid metabolism troubles e.g. adiposity and hyperlipoproteinemia. The cpds. have low toxicity oral LD50 in mice >2000mg/kg.

Title Terms: CARBOXYLIC; N; ISOVALERYL; N; N; DI; ETHYLENE

Derwent Class: B03; B05

International Patent Class (Additional): A61K-031/16; C07C-103/30;
C07D-000/00
File Segment: CPI

Derwent WPI (Dialog® File 352): (c) 2002 Thomson Derwent. All rights reserved.

<input checked="" type="checkbox"/> Select All	<input type="checkbox"/> Clear Selections	<input type="button" value="Print/Save Selected"/>	<input type="button" value="Send Results"/>	Format
			<input type="checkbox"/> Display Selected	<input type="checkbox"/> Free <input checked="" type="checkbox"/>

© 2002 The Dialog Corporation plc

DIALOGWEB

Guided Search | new search | favorites | settings | cost | logoff | help |

Dynamic Search: JAPIO - Patent Abstracts of Japan
Records for: JP 51127002

save as alert... | save strategy only...

Output: Full Record | Output as: Browser | display/send
Modify: select | all | none | Records 1 of 1 In full Format | refine search | back to picklist

1. 2/19/1
00016002 CARBOXYLIC AMIDE PREPARATION METHOD THEREOF AND
PHARMACEUTICAL COMPOSITION AND MEDICINE CONTAINING SAME

Pub. No.: 51-127002 A]

Published: November 05, 1976 (19761105)

Inventor: JIIKUFURIITO RINKE

RIYUDEIGAA JITSUTO

Applicant: BAYER AG [000910] (A Non-Japanese Company or Corporation), DE
(Germany)

Application No.: 51-038348 [JP 7638348]

Filed: April 07, 1976 (19760407)

Priority: 2515146 [DE 2515146], DE (Germany), April 08, 1975 (19750408)

2551483 [DE 2551483], DE (Germany), November 17, 1975 (19751117)

International Class: [2] C07C-103/30; C07C-149/20; C07C-149/42; C07C-
147/00; C07C-121/00; C07D-295/18; A61K-031/16; A61K-031/185; A61K-
031/21; A61K-031/275; A61K-031/395

JAPIO Class: 14.1 (ORGANIC CHEMISTRY -- Organic Compounds); 14.4
(ORGANIC CHEMISTRY -- Medicine)

JAPIO Keyword: R019 (AEROSOLS)

JAPIO (Dialog® File 347): (c) 2002 JPO & JAPIO. All rights reserved.

©1997-2002 The Dialog Corporation -

優先権主張
国名:ドイツ連邦共和国
出願日:1975年4月8日
出願番号:DE2515146.6
出願日:1975年11月17日
出願者名:GRIFFEL-Linke
出願日:年月日
出願番号:3



(4,000円)

特許願 (特許出願に付する特許出願)

昭和51年4月7日

特許庁長官 片山石田殿
サン セイシキカワ

1. 発明の名称 カルボン酸アミド、その製造法ならびにそれを含有する繊維組成物および薬剤

2. 特許請求の範囲に記載された発明の数 4

3. 発明者

住所 ドイツ連邦共和国ベルタール1・オードルホイズ
ストラッセ50

氏名 ジークリート・リンク (ほか1名)

4. 特許出願人

住所 ドイツ連邦共和国レーフエルクーバン(ヘルガハシ)

名称 バイエル・アクチエングゼルシャフト

(氏名) ヨゼフ・シュトックハウゼン

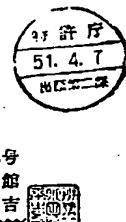
監修 ドイツ連邦共和国

5. 代理人 〒107 東京都港区赤坂1丁目9番15号

日本自転車会館

氏名(6078)井辻 小田島 吉

電話 585-2256



51 038348

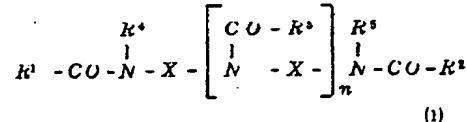
明細書

1. [発明の名称]

カルボン酸アミド、その製造法ならびにそれを含有する繊維組成物および薬剤

2. [特許請求の範囲]

1. 一般式(I)



ここに

R^1 、 R^2 および R^3 は同一であるかまたは異なつておらず且つそれ直鎖、枝分れ、環状、飽和もしくは不飽和の炭化水素基を表わし、炭素鎖は場合によりヘテロ原子または原子團によつて中断せしめてあり、且つ結合により置換せしめてあり；

X は直鎖、枝分れ、環状、飽和または不飽

⑯ 日本国特許庁

公開特許公報

⑪ 特開昭 51-127002

⑫ 公開日 昭51.(1976)11.5

⑬ 特願昭 51-38348

⑭ 出願日 昭51.(1976)4.7

審査請求 未請求 (全64頁)

序内整理番号	6742 43	6956 43
	6664 43	6956 43
	6664 43	6956 43
	6742 43	6956 43

⑮ 日本分類

16 A6	C07C103/30
16 B6	C07C149/20
16 B62	C07C149/42
16 B63	C07C147/00
16 B64	C07C147/00
16 B65	C07C121/00
16 B66	C07D295/18
16 B67	A61K31/16
16 B68	A61K31/185
16 B7	
16 C3	

最終頁へつなぐ

R^1 および R^2 は同一であるかまたは異なるおり且つ水素、亜合により置換せしめたアリールまたは直鎖、枝分れ、環状、飽和もしくは不飽和の炭化水素基を表わし、炭素鎖は場合によりヘテロ原子または原子團によつて中断せしめてあり、且つ結合により置換せしめてあり；

あるいは R^1 および R^3 は、 n が 0 を表わすときは、共同して、それらが結合している二つの窒素原子と共に窒素基式の形を形成する、アルキレン基を表わし；

あるいは R^1 および R^3 は、陰極する基 X と共に窒素を含有する基を形成する、アルキレン基を表わし；

X は直鎖、枝分れ、環状、飽和または不飽

和の炭化水素鎖を表わし、連結は結合によりヘテロ原子または原子団によつて中断せしめてあり、且つ場合により置換せしめてあり；

そして n は0または1~4の整数を表わし、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 および X において定義するすべてのアリール基は6または10炭素原子を含有し且つ結合により置換せしめてある；

を有することを特徴とする、カルボン酸アミドまたはその塩。

2. 基 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 および R^5 の中の一つまたは一つよりも多くの炭素鎖は、場合により配素または硫黄原子あるいはスルフィン、スルホン、カルボニルまたはフェニレン原子団によ

アミノカルボニル基は、場合によりアルキルまたはアリールによつて置換せしめてあるところの特許請求の範囲第1乃至3項記載の何れかによる化合物。

5. 基 R^4 および R^5 の中の一つまたは両者の炭素鎖は、場合によりヒドロキシル、アルコキシ、ハロゲン、アシロキシ、アシルアミノ、アリール、アリロキシ、アロイル、アルキルチオ、アルキルスルホン、アルキルスルフィン、シアノ、アルコキシカルボニル、アロキシカルボニルまたはアミノカルボニルによつて置換せしめてあり、一方、アミノカルボニル基は、場合によりアルキルまたはアリールによつて置換せしめてあるところの特許請求の範囲第1乃至4項記載の何れかによる化合物。

特開 昭51-127002 (2)
つて中断せしめてあるところの特許請求の範囲第1項記載の化合物。

3. 基 X の炭素鎖は、場合により配素または硫黄原子あるいはスルフィン、スルホン、アリールアザ、アルキルアザ、カルボニルまたはフェニレン原子団によつて置換せしめてあるところの特許請求の範囲第1または2項記載の化合物。

4. 基 R^1 、 R^2 および R^3 の中の一つまたは一つよりも多くの炭素鎖は、場合によりハロゲン、アルコキシ、アシロキシ、アリール、アリロキシ、アリールメルカブト、アロイル、アルキルメルカブト、アルキルスルフィン、アルキルスルホン、アシルアミノ、アロイルアミノ、シアノ、アルコキシカルボニル、アロキシカルボニルまたはアミノカルボニルによつて置換せしめてあり、一方、

6. 基 X の炭素鎖は、場合によりハロゲン、アルコキシ、アロキシ、ヒドロキシ、シアノ、ヒドロキシカルボニル、アルコキシカルボニル、アシルアミノ、アロキシカルボニル、アルキルチオ、アルキルスルフィン、アルキルスルホン、アリルチオ、アリールまたはアミノカルボニルによつて置換せしめてあり且つ、一方、アミノカルボニル基は場合によりアルキルまたはアリールによつて置換せしめてあるところの特許請求の範囲第1乃至5項記載の何れかによる化合物。

7. R^4 および R^5 は、同一であるかまたは異なるつており、且つそれぞれ水素または場合により1~3の整数基によつて置換せしめてあるフェニルもしくはナフチルを表わし、あるいは1乃至12炭素原子を有する直鎖、枝分れ、環状、飽和

もしくは不飽和の炭化水素基を表わし、炭素錠は複合により旨素、硫黄、スルホン、スルフィン、カルボニルまたはフェニレンの原子団によつて中断せしめてあり、且つ複合によりヒドロキシル；1乃至12炭素原子を有するアルコキシ；フッ素；塩素；臭素；沃素；それぞれ1乃至15炭素原子を有するアシロキシまたはアシルアミノ；アリール；アリロキシ；アロイル；1乃至12炭素原子を有するアルキルチオ、アルキルスルホンまたはアルキルスルフィン；シアノ；1乃至12炭素原子を有するアルコキシカルボニル；アロキシカルボニルまたはアミノカルボニルにより置換せしめてあり且つ一方アミノカルボニル複合により1乃至6炭素原子を有するアルキルによつて置換せしめてあり；あるいはロガロを表わすときは、

R¹ および R² は、共に向して、二つの旨素原子と共に環を形成する、1乃至4族素原子を有するアルキレン錠を表わし、あるいは置換基 R³ および R⁴ の中の一つは、隣接する X と共に旨素含有環を形成する、1乃至5族素原子を有するアルキレン基を表わし、X は2乃至15族素原子を有する直鎖、枝分れ、環状、飽和または不飽和の炭化水素基を表わし、連鎖は複合により旨素、硫黄、スルフィン、スルホン、アリールアザ、1乃至6炭素原子を有するアルキルアザ、カルボニルまたはフェニレンによつて中断せしめてあり、且つ連鎖は場合によりフッ素；塩素；臭素；1乃至6炭素原子を有するアルコキシ；アロキシ；ヒドロキシル；シアノ；ヒドロキシカルボニル；1乃至15炭素原子を有するアルコキシカルボニル；1乃至

15炭素原子を有するアシルアミノ；アロキシカルボニル；複合により1乃至6炭素原子を有する一つまたは二つのアルキル基によりあるいはアリール、それぞれアルキル基中に1乃至6炭素原子を有するアルキルチオ、アルキルスルフィンおよびアルキルスルホンによつて置換せしめてあるアミノカルボニル；一方においてハロゲン、それぞれ1乃至4炭素原子を有するアルキル、アルコキシ、アシルまたはアルキルメルカブト、シアノまたはアミノによつて置換せしめてあつてもよいアリールチオ、フェニルをあるいはナフチルによつて置換せしめてあるところの特許請求の範囲第1乃至6項記載の何れかによる化合物。

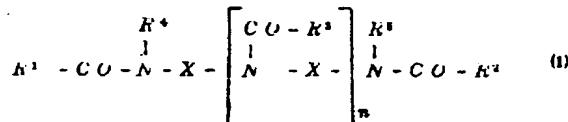
8. R¹、R² および R³ の中の一つまたは一つよりも多くが1乃至14炭素原子を有する直鎖、

枝分れ、環状、飽和または不飽和の炭化水素基を表わし、炭化水素錠は複合により旨素、硫黄、スルフィン、スルホン、カルボニルまたはフェニレンによつて中断せしめてあり、且つ複合によりフッ素；塩素；臭素；1乃至12炭素原子を有するアルコキシ；1乃至12炭素原子を有するアシロキシ；アリール；アリロキシ；アリールメルカブト；アロイル；それぞれ1乃至6炭素原子を有するアルキルメルカブト、アルキルスルフィンおよびアルキルスルホン；1乃至1.5炭素原子を有するアシルアミノ；アロイルアミノ；シアノ；1乃至6炭素原子を有するアルコキシカルボニル；1乃至6炭素原子を有するアルキルによつて置換せしめてあつてもよいアロキシカルボニルまたはアミノカルボニル；一方においてハロゲン、それぞ

れ1乃至4級氨基子を有するアルキル、アルコキシ、アシリまたはアルキルメルカブト、シアノあるいはアミノによつて置換せしめてあつもよいフェニルまたはオフタルによつて置換せしめてあるところの、特許請求の範囲1乃至7項記載のいずれかの化合物。

9. 実施例12乃至15、44、45、58、59、86、87、122、130、142乃至144、153乃至159、161乃至163、166乃至169および176以外において本明細書中に特定的に記述した特許請求の範囲第1項記載の化合物。

10. 一般式(1)



ここに R^1 、 R^2 および R^4 は同一である

かまたは異なつており且つそれそれ既知、
を分離、塩基、酸和または不飽和の炭化水
素を表わし、該異性体を合併によりヘテロ
原子または原子團によつて中断せしめてあ
り、且つ各合により置換せしめてあり；

R^4 および R^2 は同一であるかまたは異な
つており且つ水素、芳香により置換せしめ
たアリールまたは直鎖、枝分れ、環状、整
不もしくは不饱和の炭化水素基を表わし、
該異性体を合併によりヘテロ原子または原子
團によつて中断せしめてあり、且つ各合に
より置換せしめてあり；

あるいは R^4 および R^2 は、 π が 0 を表わ
すときは、共同して、それらが結合してい

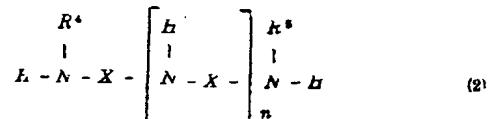
る二つの酸素原子と共に複葉基式の環を形
成する、アルキレン基を表わし；

あるいは R^4 および R^2 は、 π を有する基 X
と共に複葉基を含むする環を形成する、アル
キレン基を表わし；

X は直鎖、枝分れ、環状、酸和または不飽
和の炭化水素基を表わし、逐級は合併により
ヘテロ原子または原子團によつて中断せ
しめてあり、且つ各合により置換せしめて
あり；

そして π が 0 または 1~4 の整数を表わし、
 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 および X に
おいて定義するすべてのアリール基を含む
たび 10 個基原子を含むし且つ各合により
置換せしめてある、

る有することを特徴とする、カルボン酸アミドま
たはその塩を製造するにあたり、一般式(2)



ここに R^4 、 H^2 および X は上に定義した
とおりである、

を有するアミンを、一般式(3)



ここに B は前記のこときを表わす、 H^2
および H^3 の中の何れか一を表わし、そし
て A はヒドロキシルまたは酸原子團を活性
化する基を表わす、

を有する少なくとも一社のカルボン酸またはカル
ボン酸誘導体と、場合により酸結合剤、酸水素お

よび／または不活性ガスの存在において、反応せしめることを特と/orする方法。

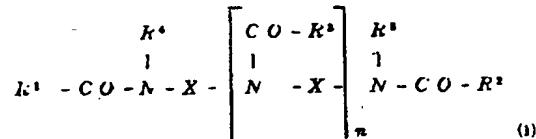
1.1. Aはハロゲン、アジド、シアノ、アルコキシ、アルキルチオ、アシロキシ、シアノメトキシ、アリロキシ、アリールチオ、アロイロキシ、スクシンイミド-N-オキシまたはフタルイミド-N-オキシを表わし、アリール基に対しては場合によりモノ置換またはポリ置換せしめることが可能であるところの実許請求の範囲第10項記載の方法。

1.2. Aはヒドロキシル；塩素；フッ素；アジド；シアノ；それぞれ1乃至4炭素原子を有するアルコキシ、アルキルチオまたはアシロキシ；シアノメトキシ；アリール基がフェニルまたはナフチルを表わし且つ場合によりハロゲン、シアノ、

165、170乃至175および177乃至198の何れか一に記載せることき実許請求の範囲第1項記載の化合物の製造方法。

1.5. 実許請求の範囲第10乃至14項記載の方法の何れか一による方法によつて製造した場合の実許請求の範囲第1項記載の化合物。

1.6. 一般式(1)



ここで、 R^1 、 R^2 および R^3 は同一であるかまたは異なつてあり且つそれぞれ直鎖、枝分れ、環状、飽和または不飽和の炭化水素基を表わし、炭素鎖は場合によりヘテロ原子または原子團によつて中断せしめてある。

スルホン、ニトロ、アミノまたはそれぞれ1乃至4が置換子を有するアルキル、アルコキシ、アルキルメルカプトまたはアシルによつてモノ置換乃至トリガ複せしめて至つてもよいアリロキシ、アリールチオ、アロイロキシ、スクシンイミド-N-オキシあるいはフタルイミド-N-オキシを表わすところの実許請求の範囲第10または11項記載の方法。

1.3. 反応は-20乃至+250°Cの温度で行かうところの実許請求の範囲第10乃至12項記載の何れかに一による方法。

1.4. 実質的に本明細書中で実施例1乃至11、16乃至43、46乃至57、60乃至85、88乃至121、123乃至129、131乃至141、145乃至152、160、164乃至

り、且つ場合により置換せしめてあり；
 R^1 および R^2 は同一であるかまたは異なるおり且つ水素、窒素により置換せしめたアリールまたは西素、枝分れ、環状もしくは不飽和の炭化水素基を表わし、炭素基は場合によりヘテロ原子または原子團によつて中断せしめてあり、且つ場合により置換せしめてあり；
 あるいは R^1 および R^2 は、 n が0を表わすときは、共通して、それらが結合している二つの空席子と共に複雑形式の基を形成する、アルキレン基を表わし；
 あるいは R^1 および R^2 は、隣接する基 X と共に空席を含有する環を形成する、アルキレン基を表わし；

X は直鎖、枝分れ、環状、飽和または不飽和の炭化水素鎖を表わし、連鎖は場合によりヘテロ原子または原子団によつて中断せしめてあり、且つ場合により置換せしめており；

そして ν は0または1～4の整数を表わし、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 および X において定義するすべてのアリール基は6または10炭素原子を含有し且つ場合により置換せしめてある。

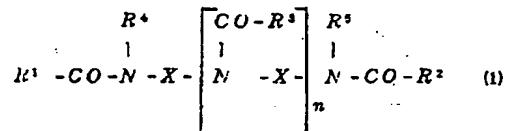
を有することを特徴とする、カルボン酸アミドまたはその塩を、活性成分として、固体または液化ガス状有機剤と混合して、あるいは界面活性剤の存在を除いて200よりも小さい分子量の溶剤以外の液体有機剤と混合して含有する製薬組成物。

り、且つ場合により置換せしめてあり；
 R^4 および R^5 は同一であるかまた異なつておき且つ水素、場合により置換せしめたアリールまたは直鎖、枝分れ、環状、飽和もしくは不飽和の炭化水素基を表わし、炭素鎖は場合によりヘテロ原子または原子団によつて中断せしめてあり、且つ場合により置換せしめてあり；
 あるいは ν^1 および ν^2 は、 ν が0を表わすときは、共同して、それらが結合している二つの炭素原子と共に複素環式の環を形成する、アルキレン鎖を表わし；
 あるいは R^4 および R^5 は、隣接する基とと共に窒素を含有する環を形成する、アルキレン基を表わし；

17. 活性成分として無菌または等張水溶液の形態にある特許請求の範囲第16項記載の製薬組成物。

18. 重量で0.5乃至95%の該活性成分を含有する特許請求の範囲第16または17項記載の組成物。

19. 一般式(1)



ここに、 R^1 、 R^2 および R^3 は同一であるかまたは異なるつており且つそれぞれ直鎖、枝分れ、環状、飽和または不飽和の炭化水素基を表わし、炭素鎖は場合によりヘテロ原子または原子団によつて中断せしめてあ

X は直鎖、枝分れ、環状、飽和または不飽和の炭化水素鎖を表わし、連鎖は場合によりヘテロ原子または原子団によつて中断せしめてあり、且つ場合により置換せしめてあり；

そして ν は0または1～4の整数を表わし、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 および X において定義するすべてのアリール基は6または10炭素原子を含有し且つ場合により置換せしめてある。

を有することを特徴とする、カルボン酸アミドまたはその塩を包含する投棄単位形態にある薬剤。

20. 銛剤、丸剤、糖剤、カプセル剤、アンプル剤または坐薬の形態にある特許請求の範囲第19項記載の薬剤。

21. 単独でまたは希釈剤との混合物としての何れかで、あるいは特許請求の範囲第19または20項記載の薬剤の形態において、特許請求の範囲第1乃至9および15項記載の何れか一による活性化合物を動物に投与することを特徴とする、人間および非人間動物における過脂肪血症と較かうための方法。

22. 活性化合物を1日当たり体重1%について0.5乃至5.0mgの量で投与するところの特許請求の範囲第21項記載の方法。

23. 活性化合物を経口的に投与するところの特許請求の範囲第21または22項記載の方法。

24. 実施例12乃至15、44、45、58、59、86、87、122、130、142乃至144、153乃至159、161乃至163、

166乃至169および176の何れか一に特定的に記載せる特許請求の範囲第1項記載の化合物。

25. 実質的に、実施例12乃至15、44、45、58、59、86、87、122、130、142乃至144、153乃至159、161乃至163、166乃至169および176の何れか一において記載せる特許請求の範囲第1項記載の化合物の製造方法。

26. 特許請求の範囲第24項記載の方法によつて製造した特許請求の範囲第1項記載の化合物。

27. 活性成分は特許請求の範囲第24または26項記載の化合物であるところの特許請求の範囲第16乃至18項記載のごとき製薬成物。

28. 胶化合物は特許請求の範囲第24または26項記載の化合物であるところの特許請求の範

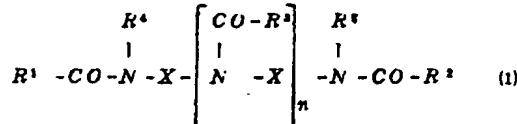
範囲第19または20項記載のごとき聚酰。

29. 活性化合物は特許請求の範囲第24または26項記載の化合物であるところの特許請求の範囲第22または23項記載のごとき方法。

3. [発明の詳細を説明]

本発明は新規カルボン酸アミド類、それらの製造法、および薬剤として、特に血中脂肪低下剤としての、それらの使用に関するものである。

本発明によれば、一般式(I)



ここで R^1 、 R^2 および R^3 は、同一であるかまたは異なつており且つそれぞれ、直鎖、枝分れ、環状、飽和または不飽和炭化

水素基を含わし、反対位は本位によりたとえは酸素、硫黄、スルフィン、スルホン、カルボニルまたはフェニレンのような、二価のヘテロ原子または原子团によつて中断せしめてあり、且つ場合によりたとえばハロゲン、アルコキシ、アシロキシ、アリール、アリロキシ、アリールメルカブト、アロイル、アルキルメルカブト、アルキルスルファンおよびアルキルスルホン、アシルアミノ、アロイルアミノ、シアノ、アルコキシカルボニル、アロキシカルボニルまたはアミノカルボニルによつて置換せしめており且つ一方アミノカルボニルは場合によつてはアルキルまたはアリールによつて置換せしめてあり。

R^4 および R^5 は同一であるかまたは異なる
つであり且つそれぞれ水素、亜結合により置換せしめてあるアリールまたは直鎖、枝分れ、環状、飽和あるいは不飽和炭化水素基を表わし、基团数は結合により、たとえば
酸素、硫黄、スルホン、スルфин、カルボニルまたはフェニレンのような、ヘテロ原子または原子団によつて中断せしめてあり、且つ結合により、たとえばヒドロキシル、アルコキシ、ハロゲン、アシロキシ、
アシルアミノ、アリール、アリロキシ、アロイル、アルキルチオ、アルキルスルホン
およびアルキルスルфин、シアノ、アル
コキシカルボニル、アロキシカルボニルまたは
アミノカルボニルのような置換基によ

つて置換せしめており且つ一方アミノカルボニル基は結合によりアルキルまたはアリール基によつて置換せしめており、あるいは
 R^4 および R^5 は、 α が 0 を表わすとき
にヒ、共通して、それらが結合している二
つの置換原子と共に基團模式の基を形成す
るアルキレン基を表わし、あるいは R^4 ま
たは R^5 は、既存する X と共に、基團を含
有する基を形成するアルキレン基を表わし、
又は直鎖、枝分れ、環状、飽和または不飽
和炭化水素連鎖を表わし、連鎖は結合によ
り、たとえば酸素、硫黄、スルфин、ス
ルホン、アリールアザ、アルキルアザ、カ
ルボニルまたはフェニレンのような、ヘテ
ロ原子または原子団によつて中断せしめて

あり、且つ結合によりたとえねハロゲン、
アルコキシ、アロキシ、ヒドロキシ、シア
ノ、ヒドロキシカルボニル、アルコキシカル
ボニル、アシルアミノ、アロキシカルボ
ニル、アルキルチオ、アルキルスルфин、
アルキルスルホン、アリールチオ、アリ
ールまたはアミノカルボニルのような置換基
によつて置換せしめてあり、且つ一方アミ
ノカルボニル基は結合によりアルキルまたは
アリールによつて置換せしめてあり、且
つ α は 10 万至 4 の整数、または 0 を表わ
し、そして

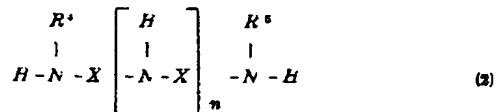
R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 および X の
もとに記したアリール基は 6 または 10 C
原子を含めし且つ結合により置換せしめて

ある。

を有する新規カルボン酸アミド類およびその塩類
が提供される。

本発明の化合物（すなわち、式(I)のアミドお
よびそれらの塩類）は血中脂肪低下性を示す。そ
れ故、本発明の化合物が疾患である場合には、医
薬として受容できる塩類がもつとも重複且つ好適
である。

さらにもう、本発明の化合物に、一般式(2)



ここで R^4 、 R^5 および X は前記の意義を
有する。

のアミン類またはその塩類を、一もまたは一整

りも多い一般式(3):

B-CO-A

(3)

これより前記のととき酸基 R^1 、 R^2 および R^3 の半の何れか一つを表わし、且
ニ
Aにヒドロキシルまたは、たとえはハロゲン、アジド、シアノ、アルコキシ、アルキルテオ、アシロキシ、シアノメトキシ、アリロキシ、アリールテオ、アロイロキシ、スクシンイミド-N-オキシ、またはフタルイミド-N-オキシのようか、酸基を活性化する点を表わし、アリール基ICに対しては結合によりモノ置換またはポリ置換せしめることが可能である。

カルボン酸基またはカルボン酸誘導体と、物

合により、酸結合剤または脱水剤および不活性剤の存在において、反応せしめることによつて取扱ふことができるといふことが見出された。

化合物は、塩アミドの形態で、またその塩の形態で、単離することができる。塩アミドおよびその塩は、本法によつて相互に置換せしめふことができる。

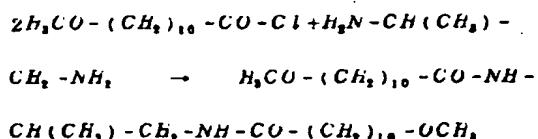
カルボン酸誘導体とジアミンおよびポリアミンとの反応は、段階的に行なうこともできる。

酸基として、ヒドロキシルまたはアミノ基を有している一般式(4)の化合物の結合には、引抜く、これらの官能基のアシル化を行なうこともできる。

近縁アミンの代りに、本発明による反応に対し、アミンを放出する化合物を使用することもまた可能である。

次くべきことに、本発明によるカルボン酸アミド基は、多力を血中脂肪低下を示す。従来、本発明による化合物の効果からは、匹敵する作用を有する化合物は明らかにされていない。本発明による化合物はさらに弱かな血中脂肪低下とみなすべきである。これらは、多糖ICに対する添加剤として使用することもできる。

出発材料として、1,1-メトキシ-ウンデカンジクロリドおよび1,2-ジアミノプロパンを使用する場合、反応の経過は、次式によつて表わすことができる:



本発明において使用することができる一般式(4)

のアミン類は公知であるか、または公知の方法

[ペタイ (S. Petai) (編者)、アミノ基の化学、インターナイエンス・ブリッジ・ヤーズ、ロンドン、ニューヨーク、シドニー、1968；サンドラー (S. R. Sandler) およびカロ (W. Caro)、官能基開裂、第1巻、318頁、アカデミック・プレス、ニューヨークおよびロンドン、1968；シュナイダー (W. Schneider)、ホーリー (J. Hoyer)、エーレンスタイン (W. Ehrenstein)、ヘラー (R. Heller)、ホイゼル (W. Häussel)、レーマン (K. Lehman)、ロス (J. J. Roth)、シエネンベルガー (Schönenberger)、カメリノ (B. Camerino)、カイネリ (G. F. Cainelli)、フアーレス (M. Ferles) およびコルテ (F. Korte)、化学の新方法 (Methodum Chimicum)、第6巻、

449頁、ゲオルクチーメ (Georg Thieme) 出版、シュトゥクトガルト、1974年; およびフーベン・ワイル (Houben-Weyl)、有機化学の話方法 (Methoden der Organischen Chemie), 第11/1巻、ゲオルクチーメ出版、シュトゥクトガルト 1957]に従つて合意することができる。

本発明に従つて使用することができる一般式(2)のアミンについて挙げることができる例は、次のものである: 1, 2-ジアミノエタン、N-メチル-1, 2-ジアミノエタン、N, N'-ジイソプロピル-1, 2-ジアミノエタン、N-メチル-N'-エチル-1, 2-ジアミノエタン、N-ブロビル-1, 2-ジアミノエタン、N, N'-ビス[2

-ブロムエチル]-1, 2-ジアミノエタン、N, N'-ジベンデル-1, 2-ジアミノエタン、N-オクチル-1, 2-ジアミノエタン、N, N'-ジヘキサデシル-1, 2-ジアミノエタン、N-アリル-1, 2-シアミノエタン、N, N'-ジメタアリル-1, 2-ジアミノエタン、ビス-[2-アミノエチル]-アミン、2, 2'-ビス-[メチルアミノ]-ジエチルアミン、1-ブチル-ジエチレントリアミン、1, 5-ジアミノ-3, 6-ジアザオタン、1, 11-ジアミノ-3, 6, 9-トリアザ-ウンデカン、メチル-ビス-[2-アミノエチル]-アミン、1, 4, 7-トリブチル-ジエチレントリアミン、N, N'-ジ-(エ-メチル)-ブロビレンジアミン、N, N'-ジ-(エ-ブチル)-ブロビレンジアミン、

3-アミノ-1-メチルアミノ-ブロパン、1, 3-ビス-メチルアミノ-ブロパン、1, 3-ビス-ヘプチルアミノ-ブロパン、3-アミノ-1-ドデシルアミノブロパン、1, 9-ジアミノ-3, 7-ジアザノナン、1, 2-ジアミノ-ブタン、2-アミノ-1-ドデシルアミノ-ブタン、1, 3-ビス-エチルアミノ-ブタン、4-アミノ-1-(3-ブロモブロビルアミノ)-ブタン、4-アミノ-1-イソベンデルアミノブタン、2, 3-ジアミノブタン、1, 2-ジアミノ-2-メチルブロパン、2-アミノ-1-メチルアミノ-2-メチルブロパン、2-アミノ-1-ブチルアミノ-2-メチルブロパン、4-アミノ-1-イソブロビルアミノ-ブンタン、1, 4-ジアミノブンタン、1, 2-ジアミノ-ブンタン、

2, 4-ジアミノ-ベンタン、1, 3-ジアミノ-2-メチル-ブタン、1, 3-ジアミノ-2, 2-ジメチル-ブロパン、1, 6-ジアミノヘキサン、1, 6-ビス-ブロビルアミノ-ヘキサン、1, 4-ジアミノ-2, 3-ジメチル-ブテン②、1, 4-ビス-メチルアミノ-ブチン②、1, 4-ビス-ブチルアミノ-ブチン②、1, 2, 3-トリアミノブロパン、ビス-[2-アミノエチル]-エーテル、2, 3-ジアミノ-1-メトキシ-ブロパン、ビス-[2-アミノエチル]-スルホキシド、ビス-[2-アミノエチル]-スルホン、ビス-[2-アミノエチル]-ジスルフイト(=シスタミン)、2, 6-ジアザ-スピロ-[3, 8]-ヘブタン、1, 4-ジアザ-スピロ-[4,

5] デカン、2-クロル-1,3-ジアミノ-ブロバン、1,3-ジアミノ-2-ヒドロキシプロパン、N,N-ジエチル-1,3-ブタジエン-1,4-ジアミン、1,8-ジアミノ-2,5-オクタジエン、1,8-ジアミノ-3,6-オクタジエン、2,3-ジアミノ-ビシクロ[2,2,2]オクタン、N,N'-ジフェニル-エテレンジアミン、N,N'-ジベンジル-エテレンジアミン、エテレングリコール-ビス-[2-メチルアミノエチル]-エーテル、2,2'-ビス-メチルアミノ-ジエチルエーテル、1,6-ジアミノ-シクロヘキセン-(1)、2,3-ジアミノ-ノルボルナン、1,3-ジアミノプロパン、2,6-ジアミノ-2,6-ジメチル-ヘプタン-4)、3,4-ジアミノ-アジピン酸、

3,4-ジアミノ-アジピン酸エチルエステル、3,4-ジアミノ-アジピン酸-ジ-ル-ブチルエステル、3,4-ジアミノ-アジピン酸ジアミド、2,9-ジアミノ-セバテン酸、1,2-ジアミノ-シクロブタン、1,2-ジアミノ-シクロペンタン、1,2-ジアミノ-シクロヘキサン、2-アミノ-1-アミノメチル-シクロペンタン、1,4-ジアミノシクロオクタン、3,5-ジアミノ-1,1-ジメチルシクロヘキサン、1,6-ジアミノ-シクロデカン、2,3-ジアミノ-プロピオン酸、2,3-ジアミノ-プロピオン酸ニトリル、2,3-ジアミノ-プロピオン酸アミド、2,3-ジアミノ-プロピオン酸-メチルエステル、2-アミノ-1-メチルアミノ-プロピオン

酸エチルエステル、1,2-ビス-[メチルアミノ]-プロピオン酸、1,2-ビス-[メチルアミノ]-プロピオン酸-エチルエステル、2,3-ジアミノ-脂肪酸、2,4-ジアミノ脂肪酸、2,5-ジアミノ-吉草酸(オルニチン)、2,5-ジアミノ-吉草酸-メチルエステル、2,5-ジアミノ-ヘキサン酸(リシン)、2,6-ジアミノ-ヘキサン酸-エチルエステル、6-アミノ-2-メチルアミノ-ヘキサン酸、2-アミノ-6-メチルアミノ-ヘキサン酸-エニルエステル、ビペラジン、1,3-ジアミノ-2,2,4,4-テトラメチル-シクロブタン、1,5-ジアザ-シクロオクタン、2,5-ジメチル-ビペラジン、1-アミノ-2-アニリノ-ブロバン、1-アミノ-2-

アニリノ-ブタン、N,N-ビス-[アミノエチル]-アニリン、N-フェニルエチレンジアミン、4-アミノベンジルアミン、1-フェニル-エチレンジアミン、N,N'-ビス-[4-クロロフェニル]-ブロバン-1,3-ジアミン、N-ベンジル-N'-フェニル-エチレンジアミン、N,N'-ジフェナシル-エチレンジアミン、N,N'-ビス-(2-メチルメルカプトメチル)-エチレンジアミン、N,N'-ビス-(2-メチルスルホニル-エチル)-エチレンジアミン、N,N'-ビス-(α-メチルベンジル)-エチレンジアミン、N,N'-ジベンジル-エチレンジアミン、1,1,10,10テトラメチル-トリエチレンテ

トラン、1,10-ジメチル-1,10-ジフ
エニル-トリエチレンテトラミン、2,2,10,
10-テトラメチル-3,9-ジオキソ-5,8
-ジアザ-ウンデカシ、N,N'-ビス-(2-
ア-トリルエチル)-エチレンジアミン、N-ヒ
ドロキシエチル-エチレンジアミン、N-クロル
エチル-エチレンジアミン、N,N'-ビス-(
(2-ヒドロキシエチル)-エチレンジアミン、
N,N'-ビス-(2-クロルエチル)-エチ
レンジアミン、N,N'-ビス-(3-エトキシブ
ロビル)-エチレンジアミン、N,N'-ビス-(
(3-メトキシエチル)-エチレンジアミン、
N,N'-ビス-(2-フェノキシエチル)-エ
チレンジアミン、N,N'-ビス-(2-ア-ブ
チルカルボニルカブトエチル)-エチレンジアミン、

N,N'-ビス-(2-ブチルスルホニルエチル)
-エチレンジアミン、N,N'-ビス-(2-ア
-ブチルスルフィニルエチル)-エチレンジアミ
ン、N,N'-ビス-(2-エチルカルボニルメ
チルスルホニル-エチル)-エチレンジアミン、
N,N'-ビス-(2-シアノエチル)-エチ
レンジアミン、N,N'-ビス-(2-フェニルメ
ルカブトエチル)-エチレンジアミン。

式(2)において、

R⁴ および R⁵ は新しいかまたは異なるもの
であり且つ好ましくは水素または基合により
1~3 の置換基によつて置換せしめてある。フ
エニルあるいはナフチルを表わしましたは 1~
12 C 原子を有する直鎖、枝分れ、環状、飽
和あるいは不飽和炭化水素基を表わし、炭素

鎖は基合により、たとえは酸素、硫黄、スル
ホン、スルフィン、カルボニルまたはフェニ
レンのようか、ヘテロ原子または原子團によ
つて中断せしめてあり、且つ場合によりたと
えばヒドロキシル、1~12 C 原子を有する
アルコキシ、フッ素、塩素、臭素または沃素
のようなハロゲン、それぞれ 1~15 C 原子
を有するアシコキシまたはアシルアミノ、ア
リール、アリロキシ、アロイル、アルキルチ
オ、1~12 C 原子を有するアルキルスルホ
ンおよびアルキルスルフィン、シアノ、1~
12 C 原子を有するアルコキシカルボニル、
アロキシカルボニルまたはアミノカルボニル
のような置換基によつて置換せしめてあり、
且つ一方アミノカルボニル基は場合により

1~6 C 原子を有するアルキル、フェニルま
たはナフチルによつて置換せしめてあり、あ
るいは、R⁶ を表わすときは、

R⁴ および R⁵ は共同して、二つの窒素原子
と共に塩を形成する、1~4 C 原子を有する
アルキレン基を表わし、あるいは置換基 R⁶
および R⁷ の一つは、隣接する X と共に
塩素を含有する塩を形成する、1~5 C 原子
を有するアルキレン基を表わし、

X は 2~20、特に 2~15、C 原子を有す
る直鎖、枝分れ、環状、飽和または不飽和炭
化水素鎖を表わすことが好ましく、この連鎖
に対しては場合により、たとえは酸素、硫黄、
スルフィン、スルホン、アリールアザ、1~
6 C 原子を有するアルキルアザ、カルボニル

特開昭51-127002(13)

接せしめてあり、且つ上記の各アリール基は、
特に、フェニルまたはナフチルを表わし、一
方、それらはヘロゲン、たとえばフッ素、塩
素または臭素、それぞれ1~4C原子を有す
るアルキル、アルコキシ、アシルまたはアル
キルメルカブト、シアノまたはアミノによつ
て置換せしめることができ、且つ α は0乃至
4の整数を表わす。

またはフェニレンのようなヘテロ原子または
原子团によつて中止せしめることが可能であ
り、且つこの運転は結合によりたとえばヘロ
ゲン、特にフッ素、塩素または臭素、1~6
C原子を有するアルコキシ、アロキシ、ヒド
ロキシル、シアノ、ヒドロキシカルボニル、
1~15C原子を有するアルコキシカルボニ
ル、1~15C原子を有するアシルアミノ、
アロキシカルボニル、結合により一つまたは
二つの1~6C原子を有するアルキル基または
アリールによつて置換せしめてあるアミノ
カルボニル、それぞれアルキル基中に1~6
C原子を有するアルキルチオ、アルキルスル
フィンおよびアルキルスルホン、アリールチ
オまたはアリールのような置換基によつて置

本発明によつて使用することができるカルボン
酸およびカルボン酸誘導体は、公知であるかまた
は公知の方法〔サンドラーおよびカロ、有機官能
基測定、196頁、アカデミックプレス、ニュー
ヨークおよびロンドン1968；バタイ総、カル
ボン酸およびエステルの化学、インターライエン
ス・パブリッシュヤーズ、ロンドン、ニューヨーク、

シドニー、トロント、1969年；ヘネツカ(H.
Hennecka)、フーベン-ワイル、有機化学の前方
段、第8巻、359頁、グオルグラーーメ出版、シ
ュトウツガルト、1592；アンセル(M. S.
Ansell)、バタイ総、アシルハライドの化学、
35頁、インターライエンス・パブリッシュヤーズ、
ロンドン、ニューヨーク、シドニー、トロント
1972年；およびコルテ、化成の新方法、第8
巻、527頁、グオルグラーーメ出版、シュトウツ
ガルト(印刷中)に従つて該査することかで
きる。

本発明に従つて使用することができるカルボン
酸およびカルボン酸誘導体について挙げることの
できる例は、次のものである：無水酢酸、トリフ
ルオロ酢酸、塩化クロロアセチル、無水プロピオ

ン酸、塩化3-クロロプロピオニル、無水酛酸、
4-クロロ酢酸クロリド、ベンタノ酸、2-メチ
ル-ブタン酸、3-メチル-ブタン酸クロリド、
ビバリン酸クロリド、ビバロイルアシド、ヘキサ
ン酸フェニルエステル(カブロン酸フェニルエス
テル)、ヘキサン酸アシド、2-クロロヘキサン
酸メチルエステル、6-クロロヘキサン酸エチル
エステル、6-ブロモヘキサン酸エチルエステル、
2-メチル-1-ベンタノ酸、4-メチルベンタ
ノ酸クロリド(イソカブロン酸クロリド)、3-
メチル-1-ベンタノ酸、3,3-ジメチル-1-
ブタン酸クロリド、ジエチル酢酸クロリド(2
-エチル-1-ヘキサン酸)、無水ヘプタン酸、
2-メチル-1-ヘキサン酸、4-メチル-1-
ヘキサン酸、2,2-ジメチル-1-ヘキサン酸、

4 - ジメチル - 1 - ベンタン酸、3, 4 - ジメチルベンタン酸クロリド、オクタン酸フェニルエステル(カプリル酸フェニルエステル)、オクタン酸クロリド、2 - メチル - ヘプタン酸メチルエステル、2 - エチル - ヘキサン酸クロリド(ジプロピル酸クロリド)、4 - メチル - ヘプタン酸、3 - エチル - ヘキサン酸、2, 2 - ジエチルブタン酸クロリド(トリエチル酢酸クロリド)、2 - イソプロピル - 3 - メチル - ブタン酸(ジイソプロピル酢酸)、2, 2, 3, 3 - テトラメチル酢酸クロリド、ノナン酸(ペラルゴン酸)、2 - メチル - オクタン酸エチルエステル、4, 5 - ジメチル - 1 - ヘプタン酸、3 - メチル - 2 - プロピル - ベンタン酸クロリド、デカン酸クロリド(カプリン酸クロリド)、2 - メチル - ノナン

酸、3 - メチル - ノナン酸、4 - メチル - ノナン酸、2 - プチル - ベンタン酸クロリド、2, 7 - ジメチル - 1 - オクタン酸、3 - エチル - 6 - メチル - ヘプタン酸クロリド、ウンデカン酸、ウンデカン酸クロリド、8 - シクロプロピル - ノナンカルボン酸、11 - クロロ - 1 - ウンデカン酸クロリド、10 - プロモ - 1 - ウンデカン酸、11 - プロモ - 1 - ウンデカン酸、11 - イオド - 1 - ウンデカン酸、3 - メチル - デカン酸クロリド、4 - メチル - デカン酸クロリド、3, 8 - ジメチル - 1 - ノナン酸、2 - プチル - 3 - メチル - 1 - ヘキサン酸、5 - プロピル - 1 - オクタン酸、2, 2 - ジプロピル - 1 - ブタン酸クロリド(トリプロピル酢酸クロリド)、ドデカン酸(ラウリ

ン酸)、ドデカン酸クロリド、2 - メチル - 1 - ウンデカン酸、9 - シクロプロピル - ノナン酸メチルエステル、トリテカン酸クロリド、2 - メチル - ドテカン酸クロリド、テトラテカン酸(ミリスチン酸)、テトラテカン酸クロリド、テトラデカン酸S - メチルエステル、テトラテカン酸S - エチルエステル、2 - エチル - 1 - ドデカン酸、クロトン酸、メタクリル酸、2 - ヘキサン酸クロリド、4 - メチル - ベント - 4 - エン - 1 - オン酸、4 - メチル - ベンタン酸クロリド、ヘプト - 2 - エン - 1 - オン酸クロリド、オクト - 2 - エン - 1 - オン酸クロリド、ノン - 8 - エン - 1 - オン酸クロリド、テク - 2 - エン - 1 - オン酸クロリド、3 - メチル - ノン - 2 - エノン酸、2 - アリル - 1 - ヘプタノン酸、ウンデク - 10 - オン酸、

シ - 1 - オン酸、ウンデク - 10 - エノン酸クロリド、ウンデク - 2 - エン酸、2 - アリル - 1 - オクタン酸、ウンデク - 10 - イン - 1 - オン酸、ウンデク - 9 - イン - 1 - オン酸、ウンデク - 5 - イン - 1 - オン酸、2, 4 - ヘキサジエン - 1 - オン酸クロリド(ソルビン酸クロリド)、4, 8 - ウンデカジエン - 1 - オン酸、2, 4, 6 - オクタトリエン - 1 - オン酸、シクロヘキサンカルボン酸、3 - シクロヘキシル - プロピオン酸メチルエステル、3 - シクロヘキサン - 1 - カルボン酸、ケイ皮酸クロリド、トランス - ケイ皮酸イソペンチルエステル、2 - メチルケイ皮酸クロリド、3 - メチルケイ皮酸メチルエステル、フェニル - アセチレンカルボン酸メチルエステル、フェノキシ - チオ酢酸S - フエニルエステル、フェノ

キシ酢酸カーニトロフェニルエステル、メトキシ酢酸メチルエステル、11-メトキシ-ウンデカン酸、6-ブトキシ-ヘキサン酸、6-フェノキシ-ヘキサン酸、6-(α -第三-ブチルフェニルメルカブト)-ヘキサン酸、2-フェノキシ-ウンデカン酸、フェニルメルカブト酢酸エチルエステル、6-(α -ブチルメルカブト)-ヘキサン酸、6-(α -ブチル-スルフイソ)ヘキサン酸、6-(α -ブチルスルホン)-ヘキサン酸、 α -オクチルメルカブト酢酸エチルエステル、 α -オクチルスルフイソ-酢酸エチルエステル、 α -オクチル-スルホン酢酸エチルエステル、11-シアノ-ウンデカン酸、9-シアノ-ノナン酸、8-シアノ-オクタン酸、ジケテン、N-ブチル-N-メチルタリシン、N-メチル-N-フェニ

ルグリシン、11-フェニル-メルカブト-ウンデカン酸、11-アセトキシ-ウンデカン酸、6-(α -トリル)-ヘキサン酸、4-トリル-酢酸クロリド、グルタル酸モノエチルエステル、グルタル酸モノ-アミニド、アジピン酸モノエチルエステル、アジピン酸エチルエステル-クロリド、アジピン酸モノアミド、ビメリン酸メチルエスル-クロリド、ビメリン酸モノアミド、ビメリン酸エチルエスル-クロリドおよびスペリン酸モノエチルエスル-クロリド。

異なる基 R^1 、 R^2 および R^3 を包含する本発明の化合物を調製することを希望する場合は、式(3)の化合物の混合物を使用する。

式(3)において、

B は、同一または異なるものとすることができる。

き且つ、一方、1~14C原子を有する直鎖、枝分かれ、星状、飽和または不飽和炭化水素基を含むす三つの基 A^1 、 A^2 および A^3 を取ることか極ましく、炭化水素基に加してねを合により、たとえば酸素、硫黄、スルフイソ、スルホン、カルボニルまたはフェニレンのような、二価のヘテロ原子または原子團によつて置換せしめることが可能であり、且つ炭化水素基は合によりたとえばハロゲン、特にフッ素、塩素または臭素、1~12C原子を有するアルコキシ、1~12C原子を有するアシロキシ、アリール、アリロキシ、アリールメルカブト、アロイル、アルキルメルカブト、それぞれ1~6C原子を有するアルキルスルフイソおよびアルキルスルホン、

1~15C原子を有するアシルアミノ、アロイルアミノ、シアノ、1~6C原子を有するアルコキシカルボニル、アロキシカルボニルまたは1~6C原子を有するアルキルによつて置換せしめてあつてもよいアミノカルボニル、フェニルまたはナフチルによつて置換せしめてあり、且つ上記のアリール基は、特に、フェニルまたはナフチルを表わし、一方、これらはたとえばフッ素、臭素または塩素のようなハロゲン、アルキル、アルコキシ、それぞれ1~4C原子を有するアシルまたはアルキルメルカブト、シアノまたはアミノによつて置換せしめてあつてもよく、且つ A はヒドロキシルまたは酸基を活性化する基、たとえはハロゲン、特に塩素または臭素、アジド、

シアノ、アルコキシ、それぞれ1~4C原子を有するアルキルチオまたはアシロキシ、シアノメトキシ、アリロキシ、アリールチオ、アロイロキシ、スクシンイミド-N-オキシまたはフタルイミド-N-オキシを含むことが好ましく、これらの中でアリール基は、特に、フェニルまたはナフチルを含む場合によりハロケン、シアノ、スルホン、ニトロ、アミノ、アルキル、アルコキシ、それぞれ1~4C原子を有するアルキルメルカブトまたはアシルのグループからの置換基に上つてモノ置換乃至トリ置換せしめてあつてもよい。

使用することができる溶剤および希釈剤は、進行すべく反応において不活性であるすべての溶剤

メタノール、エタノール、イソプロパノールおよびカーブタノールのようなアルコール基、または水を包含する。

当ハロゲン化合物の反応に付して使用することができる無機酸は、おもに常見の無機酸である。これらは、おもしくは、トリエチルアミン、ビリジンおよびキノリンのような有機碱、および、たとえばアルカリ金属炭酸塩およびアルカリ金属水酸化物のような無機塩を包含する(フーベンワイル、有機化学の諸方法中のメラー(D. Möller)による記述、第11/2巻、10頁、1958年版)。

カルボン酸とのアミンの反応の際に、脱水は、水を共沸的に除去することによつて、または脱水

および溶剤混合物である。これらは、好ましくは、たとえばジエチルエーテル、ジオキサン、ジイソプロピルエーテルおよびテトラヒドロフランのようなエーテル類、たとえばジメチルケトンおよびメチルエチルケトンのようなケトン類、たとえば石油エーテル、リグロイン、ベンゼン、トルエンおよびキシレンのような炭化水素類、ハロゲン化炭化水素類(たとえばクロロホルムおよび塩化メチレン)、たとえば酢酸エチルおよびプロピオン酸メチルのようなエステル類、たとえばジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、ヘキサメチル銅酸トリアミドおよびテトラメチル尿素のような非プロトン溶剂、たとえばビリジンおよびキノリンのようなアミン類、さらにもう、ある種の反応に対する、たとえば

熱を加えることによつて、行かうことができる。使用することができる脱水剤は、そんゆる作用の試薬を包含する[フーベン-ワイル、有機化学の諸方法中のメラーの説述、第4版、第8巻、654頁、ケオルクチーメ出版、シュトウツトガルト、1958、サンドラーおよびカロ、有機官能基試験、第1巻、270頁、アカデミックプレス、ニューヨークおよびロンドン1968およびコルテ、化学の諸方法中のクラーツ(U. Kraatz)の説述、第6巻、682頁、ケオルクチーメ出版、シュトウツトガルト1974年版]。これらは、好ましくは、たとえばシクロヘキシルカルボジイミドのようなカルボジイミド類、たとえば五塩化窒、三塩化窒、オキシ塩化鉄、亜鉛トリアリール、トリアリールホスファイン、ヘキサクロロシグ

ロトリホスフアトリアセンのような極化合物から
びれたときはシメチルアミノアセテレン酸および
四塩化珪素のようかその他の脱水剤を包含する。

反応温度は比較的低い範囲で反応をとどめることができ
且つ利用する反応性を有する。一例に、この方法
は -20°C 乃至 25°C 、好ましくは -10°C 至
15°C の温度で行なう。

一般式(1)のアミン特に、塩として、たとえば塩
酸などまたは重亜鉛塩として、使用することもでき
る。この場合に、アミンを過剰させたために、
少なくとも部分の水の不溶または無水塩基を加え
る。

反応は常圧において行なうことができるが、過
熱のカルボン酸およびカルボン酸エステル類の反
応の場合には、オートクレーブ中で加圧下に行な

うことがあらましい。

本発明による反応を進行する際には、原則とし
て 1 アミノ基當たりに 1 モルのカルボン酸または
カルボン酸誘導体を使用する。カルボン酸および
カルボン酸誘導体は過剰に使用することもできる。

実施例において用ひる化合物のはかに、挙げ
ことができる新規化合物類は次のものである：
ビス-(2-ウンデセノイルアミノ-エチル)-
スルオノン、ビス-(2-ウンデセノイルアミノ-
エチル)-スルホキシド、ビス-(2-ウンデセ
ノイルアミノ-エチル)-スルファイト、ビス-
[2-(10-ウンデセノイル)-アミノエチル]-
スルファイト、N,N'-ビス-[2-(10-
ウンデセノイル)-アミノエチル]-アニリン、
N,N'-ビス-[2-(2-シナセノイル)]-

-アミノエチル]-アニリン、N,N'-ビス-
(2-ジエチルアセチル)-アミノエチル]-ア
ニリン、N,N'-ビス-(ジエチルアセチル)
-1,3-ジアミノ-2-メトキシ-プロパン、
N,N'-ビス-(ジエチルアセチル)-1,3
-ジアミノ-2-フェノキシ-プロパン、N,N'
-ビス-(ジエチルアセチル)-1,3-ジアミ
ノ-2-シアノ-プロパン、N,N',N"-トリ
ス-(10-ウンデセノイル)-1,2,3-ト
リアミノ-プロパン、N,N',N"-トリス-
(デカノイル)-1,2,3-トリアミノ-プロ
パン、N,N',N"-トリス-(2-エチル-ヘ
キサノイル)-1,2,3-トリアミノ-プロパ
ン、N,N'-ビス-(ジエチル-アセチル)-
1,3-ジアミノ-2-(カーブチルメルカブト)

-プロパン、N,N'-ビス-(ジエチルアセチ
ル)-1,3-ジアミノ-2-(カーブチルスル
ホニル)-プロパン、1,2-ビス-(10-ウ
ンデセノイルアミノ)-プロピオン酸、N,N'
-ビス-(10-ウンデセノイル)-1-アミノ
-1',1-ジメチル-2-メチルアミノ-エタン、
N,N'-ビス-(ドデカノイル)-1-アミノ
-1,1-ジメチル-2-メチルアミノ-エタン、
N,N'-ビス-(10-ウンデカノイル)-1
-アミノ-1,1-ジメチル-2-(カーペンチ
ルアミノ)-エタン、N,N'-ビス-(トテカ
ノイル)-1-アミノ-1,1-ジメチル-2-
(カーペンチルアミノ)-エタン、N,N'-ジ
ベンジル-N,N'-ビス-(10-ウンデセノ
イル)-エチレンジアミン、N,N'-ビス-

(10-ウンデセノイル)-1-アミン-2-ア
ミノメチル-シクロヘンタン、N,N'-ジ-
(β-フェノキシエチル)-N,N'-ビス-
(テカノイル)-エチレンジアミン、N,N'-
ジ-(β-ブチルメルカプトエチル)-N,N'-
ビス-(テカノイル)-エチレンジアミン、
N,N'-ジ-(β-ヒドロキシエチル)-N,
N'-ビス-(ヘプタノイル)-エチレンジアミ
ン、N,N'-ジ-(β-ブチルスルフィニル-
エチル)-N,N'-ビス-(テカノイル)-エ
チレンジアミン、N,N'-ジ-(β-ブチル-
スルホニルエチル)-N,N'-ビス-(テカノ
イル)-エチレンジアミン、N-(β-ヒドロキ
シエチル)-N,N'-ビス-(ノナノイル)-
エチレンジアミン、N-(β-ノナノイロキシ-

エチル)-N,N'-ビス-(ノナノイル)-エチ
レンジアミン、N-(β-シアノエチル)-N,
N'-ビス-(ノナノイル)-エチレンジアミン、
N,N'-ビス-(10-ウンデセノイル)-
N,N'-ビス-(1-エトキシカルボニルエチ
ル)-エチレンジアミン、N,N'-ビス-(6
-エトキシカルボニルヘキサノイル)-N,N'-
ビス-(1-エトキシカルボニルエチル)-エ
チレンジアミン、N,N'-ビス-(1-アミノカルボニ
ルエチル)-エチレンジアミン、N,N'-ビス-
(ウンデカノイル)-N,N'-ビス-(1-アミノカルボニ
ルエチル)-エチレンジアミン、N,N'-ビス-
(ウンデカノイル)-N,N'-ビス-(1-アミノカルボニ
ルエチル)-エチレンジアミン、N,N'-ビス-
(ウンデカノイル)-N,N'-ビス-(1-アミノカルボニ
ルエチル)-エチレンジアミン、N,N'-ビス-
(ウンデカノイル)-N,N'-ビス-(1-ジエチルアミノカルボニルエチル)

-エチレンジアミン、シスおよびトランスN,N'
-ジシクロヘキシル-N,N'-ビス-(9-ウ
ンデセノイル)-エチレンジアミン、N,N'-
ジシクロヘキシル-N,N'-ビス-(2-ウン
デセノイル)-エチレンジアミン、N,N'-ジ
シクロヘキシル-N,N'-ビス-(8-シクロ
プロピル-オクタノイル)-エチレンジアミン、
N,N'-ジエチル-N,N'-ビス-(11-
アセチルアミノウンデカノイル)-エチレンジア
ミン、N,N'-ジエチル-N,N'-ビス-
(11-イオド-ウンデカノイル)-エチレンジ
アミン、N,N'-ジイソバレリル-N,N'-
ビス-(N-ブチリル-4-アミノブチリル)-
エチレンジアミン、N,N'-ジイソバレリル-
N,N'-ビス-[N-ベンゾイル]-4-ア

ミノブチリル]-エチレンジアミン、N,N'-
ビス-(2-ウンデセノイル)-2,5-ジメ
チル-ビペラジン、シスおよびトランスN,N'
-ビス-(9-ウンデセノイル)-2,5-ジメ
チル-ビペラジン、N,N'-ビス-(N-バレ
リル-2-アミノプロピオニル)-2,5-ジメ
チル-ビペラジン、N,N'-ビス-(4-フェ
ニロオキシ-バレリル)-ビペラジン、N,N'-
ビス-(N-ヘキサノイル-N-フェニル-アミ
ノアセチル)-ビペラジン、N,N'-ビス-
(N-ヘキサノイル-N-メチル-アミノアセチ
ル)-ビペラジン、N,N'-ビス-(8-オ
クチル-オキシアセチル)-ビペラジン、N,N'-
ビス-(2-ウンデセノイル)-プロピレンジ
アミン、シスおよびトランスN,N'-ビス-

(9-ウンデセノイル)-プロピレンジアミン、
 N,N' -ビス-(α -オクチロキシーアセチル)-
 プロピレンジアミン、 N,N' -ビス-(テカ
 ノイル)-ムーリジン-アニリドおよび N,N'
 -ビス-(テカノイル)-ムーリジン-(ジール
 -プロビル)-アミド。

本発明は、血栓または消化ガス希釈剤と混合し
 た、または界面活性剤の存在を除けば200より
 も小さい(好ましくは350よりも小さい)分子
 量の溶剤以外の液体希釈剤と混合した、本発明の
 化合物を活性成分として含有する製薬組成物を提
 供する。

本発明はさらに無菌または有菌水溶液の形態に
 ある本発明の化合物を活性成分として含有する製
 薬組成物を提供する。

本発明はまた、単独、または希釈剤との混合物
 としての何れかの本発明の化合物から成る投薬単
 位形態にある薬剤をも提供する。

さらに、本発明は、単独、または希釈剤との混
 合物としての本発明の化合物を包含する錠剤(ロ
 ゼンジおよび顆粒を包含する)、軟膏、カプセル
 剤、丸剤、アンプル剤または坐薬をも提供する。

本明細書中で用いる場合の“薬剤”とは、医療
 のための投与に適する物理的に分離した複数部分
 を意味する。“投薬単位形態にある薬剤”とは、
 本明細書中で用いる際には、担体との組合わせお
 よび/または外皮内に封入せしめた状態にある本
 発明の化合物の一日量または一日量の倍数(4倍
 に至るまで)あるいは約量(少なくは1/40まで)
 を含有する医療投与に対して適する物理的に

分解した複数単位を意味する。薬剤が一日量を包
 含するかまたけ、たとえ、一日量の半分、あるいは
 いは1/4を含有するかは、それらの薬剤を、それ
 ぞれ1日に1回またけ、たとえ、2回、3回あ
 るいは4回の例れで投与すべきかによつてまる。

本発明による多变量は、たとえ、水性ま
 たは非水性希釈剤、シロップ、颗粒または粉末中
 における活性成分の糖膏、グル、泥膏、乳剤、噴
 霧剤(エーロゾルを包含する)、洗浄剤、懸液溶
 液および乳液溶の形態をとることができる。

錠剤、軟膏、カプセル剤および丸剤に成形せし
 めるために適応する製薬組成物(たとえは粒状物)
 において使用すべき希釈剤は次のものを包含する:
 (a) 充填剤および増量剤、たとえは、膨粉、糖類、
 マンニトール、および桂酸；(b)結合剤、たとえは

カルボキシメチルセルロースおよびその他のセル
 ロース誘導体、アルギン酸塩類、ゼラチンおよび
 ポリビニルピロリドン；(c)粘着剤、たとえはグリ
 セリン；(d)崩解剤、たとえは寒天、炭酸カルシウム
 および重炭酸ナトリウム；(e)溶剤遮断剤、たとえ
 ばバラフィン；(f)吸收促進剤、たとえは四巣アン
 モニウム化合物；(g)界面活性剤、たとえはセチル
 アルコール、グリセリンモノステアレート；(h)吸
 引性担体、たとえはカオリンおよびベントナイト；
 (i)潤滑剤、たとえはタルク、ステアリン酸カルシ
 ウムおよびマグネシウムならびに固体ポリエチレ
 ングリコール。

本発明の製薬組成物から形成せしめた錠剤、软
 膏、カプセル剤および丸剤は、不透明化剤をも含
 有することができる常用のコーティング、外被お

より保護マトリックスを有することができる。それらは、腸管のみにおいて、好ましくは腸管の特定部分において、できうれば所定の時間にわたつて、活性成分を放出するように構成せしめることができる。コーティング、外被および保護熱壁は、たとえば、高分子物質またはワックスからがついててもよい。

活性成分は一般または一段よりも多くの前記の希釈剤と共にミクロ被覆せしめた形態に仕上げることもできる。

坐薬にあわせしめるために適する製薬剤成物において使用すべき希釈剤は、たとえば、通常の水溶性または非水溶性希釈剤、たとえばポリエチレンクリコールおよび脂肪類（たとえばココア油および高級エステル類〔たとえばC₁₆-アルコールとC₁₈-脂肪酸との〕）またはこれらの希釈剤の

混合物、とすることができる。

軟膏、泥膏、クリーム剤およびゲル剤であるところの製薬剤成物は、たとえば、通常の希釈剤、たとえば植物性および動物性油脂類、ジクス、パラフィン、蜂蠟、トラガカント、セルロース誘導体、ポリエチレンクリコール、シリコーン剤、ペントナイト、珪酸、タルクおよび酸化錫などまたはこれらの組合せの混合物を含有することができる。

油剤および吸収剤である製薬剤成物は、たとえば、通常の油剤、たとえばラクトース、タルク、珪酸、水酸化アルミニウム、珪酸カルシウム、およびオリーブオイルまたはこれらの物質の混合物、を含有することができる。エーロゾル吸収剤は、たとえば、通常の推進剤、たとえば、クロロフルオロ炭化水素を含有することができる。

溶液および乳剤である製薬剤成物は、たとえば、通常の希釈剤（いりまでもなく、界面活性剤の存在を除けば、上面のような200よりも小さい分子量を有する希釈剤の排除のもとで）、たとえば溶剤、溶合剤および乳化剤を含有することができる；かかる希釈剤の特定例は水、エチルアルコール、イソプロピルアルコール、炭酸エチル、酢酸エチル、ベンジルアルコール、安息香酸ベンジル、ブロビレンクリコール、1,3-ブチレンクリコール、ジメチルホルムアミド、油類（たとえば葵花生油）、グリセリン、テトラヒドロフルフリルアルコール、ポリエチレンクリコールおよびソルビトールの脂肪酸エステルまたはこれらの混合物である。

非経口的投与に対しては、高液および乳剤は、

無毒であり、且つ、必要に応じ、血液凝集性でなければならない。

製薬剤である製薬剤成物はたとえば前記各剤のような混合の希釈剤、たとえば水、エチルアルコール、ブロビレンクリコール、界面活性剤（たとえげエトキシ化イソステアリルアルコール、ポリオキシエチレンソルベイトおよびソルビタンエステル類）、ミクロクリスタンセルロース、メタガセ化アルミニウム、ペントナイト、寒天およびトラガカントまたはこれらの混合物、を含有することができる。

本発明による製薬剤成物は、着色料および防腐剤ならびに香料および甜味料加剤（たとえヘッカ油およびニーカリ油）ならびに甘味料（たとえばサンカリン）をも含有することができる。

本発明による製薬新成物は、全新成物の量を対して好ましくは約0.1乃至9.5、さらに好ましくは約0.5乃至9.5%の活性成分を含有する。

本発明の化合物に加えて、本発明による製薬新成物および薬剤は、その他の医薬的に活性な化合物をも含有することができる。これらは多數の本発明の化合物を含有することもできる。

本発明の薬剤中の何らかの希釈剤は、本発明の薬剤が成形に際して先に挙げたものの中の何れかとすることができる。かかる薬剤は、单一希釈剤として200よりも小さい分子量を有する薬剤を含むことができる。

本発明による薬剤を構成する分解した複数部分（投薬単位形態にあつてもかくとも）たとえば、次のものの中の何れかとすることができる：薬剤

（ロゼンジおよび顆粒を含む）、丸剤、泡衣剤、カプセル剤、坐薬およびアンプル剤。これらの形態の中のあるものは、活性成分の遮断せしめた放出が可能なように構造することができる。たとえばカプセル剤のようなどあるものは、薬剤の部分を物理的に分離し且つ収集したものとするための保護外被を包含する。

本発明の薬剤の投与のための好適一日量は250mg乃至1000mgの活性成分である。

上記の製薬新成物および薬剤の製造は、この技術分野で公知の方法の何れかによつて、たとえば活性成分（類）を希釈剤（類）と混合して製薬新成物（たとえば粒状物）を生ぜしめ、次いでその新成物を薬剤（たとえば錠剤）に成形せしめることによつて、行なうことができる。

本発明にさらに、またに対して本発明の化合物を、丸剤または粒状剤との複合物として、あるいは乳剤によるともあらわす形態として、あらかじめから成る、人化および非人化生物学における前記の各項とあらう（子乳、製液および液滴を含む）ための方針を教示する。

これらの在院患者は、経口的、非経口的（たとえば筋肉内、皮膚内または骨髄内）、直腸内または局所的に、好ましくは経口的に、投与せしめることを考慮することができる。それ故、好適な製剤を成形および準備は、経口投与に文して適応するものである。本発明の方針における投与は、経口的であることが好ましい。

一もれ人間医学およびむく手の疾患において、活性化合物または活性化合物群は、食前または／

および食間または／および食後に、1乃至6回に分けて、2時間当たり体重1kgについて、約0.5乃至約500、好ましくは5乃至100mgの量で使用することが具合がよいことが認められている。個々の配剤は、体重1kg当たり約0.1乃至約100mgの量で、活性化合物または化合物類を含有していることが好ましい。しかしながら、上記の投与量を変えることが必要な場合もあり、特に、治療すべき対象の種類および体重、病気の種類およびおもさ、薬の製剤および配剤の種類および投与を行なう時間または間隔との關係によつて、変更しなければならないことがある。かくして、ある場合には、上記の量よりも少ない活性化合物を用いる処置で十分なこともあるし、また一方他の場合には、上記の量を超える活性化合物を必要とするこ

ともある。個々の場合に必要とする活性化合物の最適量および投与方法は、この分野の熟練者であれば、専門的な知識に基づいて、容易に決定することができる。

本発明による活性化合物は、脂肪性の食餌後に比較的低い食餌性過脂肪血症状を導き且つ同時に動物および人間によるコレステロールの吸收の抑制を導き、その結果、これらの化合物は脂肪代謝障害(たとえは、過脂肪蛋白血症または脂肪蓄積)の治療に対して使用することができる。血中脂肪低下作用を、実施例中に記す化合物を例として使用して、第1表中に示す。

ねずみに対する作用は次の試験計画を用いて実証する:

脂肪の投与による食餌性過脂肪血症を生じさせ

るために、5~10匹のねずみの群に絶口的に2.5 ml/kgのオリーブ油を与える。5~10匹の他のねずみの群に、表中に示す投与量で、活性物質をトラガカント粘液中の懸濁物として与える。投与はプロパンギを使用し且つ、一群のねずみに対しては、脂肪の投与前90分に、他の群に対しては、脂肪の投与と同時に行なう。さらに他の对照群の5~10匹のねずみには、トラガカント粘液のみを投与する。

オリーブ油の投与の2時間後に、三つのねずみの群のすべてにおいて血清中のトリグリセリドの濃度をエックスタイン(M. Eggstein)およびクロイツ(F. H. Kreutz)の方法[エックスタインおよびクロイツ,Klin. Wochr., 44, 262 (1966)]の変更方法により、ペーリンガー

(Boshringer)、マンハイム(Mannheim)両氏からの生化学的試験組合せを使用して測定する。

脂肪の投与の2時間後に、オリーブ油のみを投与したねずみは、脂肪を与えないねずみと比較して、血清中のトリグリセリドの顕著な増大を示した。この増大を100%として、それと比較したときの活性物質およびオリーブ油を投与したねずみにおける血清トリグリセリドの増大を、第1表中に百分率として示した。

第1表

名 簡	実験番号	投与量 (mg/kg)	血清トリグリセリドの 増加、% ;		P
			2回投与	(オリーブ油対照 = 100 %)	
<i>N,N'</i> -ビス-(ドテカノイル)- <i>N,N'</i> -ジメチル-エチレンジアミン	95	30	37.7		<0.001
<i>N,N'</i> -ビス-(10-ウンデカノイル)- <i>N,N'</i> -ジメチルエチレンジアミン	101	10 30	55.9 30.9		<0.001 <0.001
<i>N,N'</i> -ビス-(4-メチル-2-トリセノイル)- <i>N,N'</i> -ジメチル-エチレンジアミン	102	10 30	73.1 57.9		<0.05 <0.02
<i>N,N'</i> -ビス-(10-ウンデセノイル)- <i>N</i> -ベンジル-トリメチレンジアミン	83	30	62.2		<0.005
<i>N,N'</i> -ビス-(10-ウンデセノイル)- <i>N</i> -4-(クロロフェニル)-エチレンジアミン	77	30	56.0		<0.01
<i>N,N'</i> -ビス-(10-ウンデセノイル)-2,6-ジメチルビペラジン	172	30	29.1		<0.02
<i>N,N'</i> -ビス-(10-ウンデセノイル)- <i>N</i> -(2-エチルブチル)-エチレンジアミン	72	30	51.6		<0.005
<i>N,N'</i> -ビス-(10,11-ジブロモ-ウンデカノイル)- <i>N,N'</i> -ジメチル-エチレンジアミン	106	10 30	61.2 30.2		<0.005 <0.001

第1表続き

<i>N</i> -イソバレリル- <i>N,N'</i> -ビス-(10-ウンデセノイル)-エチレンジアミン	70	10 30	22.4 9.0		<0.001 <0.005
<i>N</i> -(3-エノキシプロピル)- <i>N,N'</i> -ビス-(10-ウンデセノイル)-トリメチレンジアミン	85	10 30	31.6 9.0		<0.001 <0.001
<i>N</i> -ベンジル- <i>N,N'</i> -ビス-(10-ウンデセノイル)-トリメチレンジアミン	83	10 30	36.5 8.5		<0.001 <0.001
<i>N,N'</i> -ビス-(10-ウンデセノイル)-ブロビレンジアミン	17	10 30	28.5 16.8		<0.001 <0.001
<i>N</i> -(2-ノルホルニルメチル)- <i>N,N'</i> -ビス-(10-ウンデセノイル)-エチレンジアミン	73	30	39.1		<0.01
<i>N,N',N''</i> -トリメチル- <i>N,N''</i> -ビス-(10-ウンデセノイル)-ジエチレン-トリアミン	123	10 30	31.6 33.2		<0.01 <0.02
<i>N,N'</i> -ジフェニル- <i>N,N'</i> -ビス-(10-ウンデセノイル)-エチレンジアミン	164	10 30	53.4 52.0		<0.01 <0.01
<i>N,N'</i> -ビス-(1-エトキカルボニルエチル)- <i>N,N'</i> -ビス-(10-ウンデセノイル)-トリメチレンジアミン	180	10	57.1		<0.05
<i>N,N'</i> -ジ-(2-ブチル)- <i>N,N'</i> -ビス-(10-ウンデセノイル)-エチレンジアミン	131	10	61.4		<0.025

第1表状況

<i>N,N'</i> -ビス-(10-ウンデセノイル)-2-アミノメチル-ビロリジン	190	10	24.6	<0.001
<i>N,N'</i> -ジイソバレリル- <i>N,N'</i> -ビス-(ウンデカノイル)-エチレンジアミン	139	10	51.4	<0.001
<i>N,N'</i> -ジ-(カーブチル)- <i>N,N'</i> -ビス-(ドテカノイル)-エチレンジアミン	129	10	43.8	<0.05
<i>N,N'</i> -ジイソバレリル- <i>N,N'</i> -ビス-(デカノイル)-エチレンジアミン	138	10	35.0*	<0.001
<i>N,N'</i> -ジシクロヘキシル- <i>N,N'</i> -ビス-(10-ウンデセノイル)-エチレンジアミン	145	10	22.2*	<0.001
<i>N,N'</i> -ジ-(n-ブトキシプロビル)- <i>N,N'</i> -ビス-(10-ウンデセノイル)-エチレンジアミン	174	10	38.1*	<0.02
<i>N,N'</i> -ジアリル- <i>N,N'</i> -ビス-(10-ウンデセノイル)-エチレンジアミン	160	10	43.8*	<0.02
<i>N,N'</i> -ビス-(デセノイル)-1,3-ジアミノ-2-ヒドロキシ-プロパン	50	10	45.1*	<0.02
<i>N,N'</i> -ビス-(10-ウンデセノイル)-2-アミノメチル-ヘキサメチレンジアミン	192	10	35.6*	<0.005

* 低下した増加(非処理対照物=100%)

第2表状況

<i>N,N'</i> -ビス-(10-ウンデセノイル)-2-メチルアミノメチル-ビペリジン	193	10	38.1*	<0.001
<i>N,N'</i> -ジイソバレリル- <i>N,N'</i> -ビス-(10-ウンデセノイル)-エチレンジアミン	141	10	56.2*	<0.01
<i>N,N'</i> -ビス-(10-ウンデセノイル)- <i>N,N'</i> -ジドデシル-エチレンジアミン	69	10	61.8*	<0.005
<i>N,N'</i> -ビス-(2-エチルヘキサノイル)-2-アミノメチル-ヘキサメチレンジアミン	197	10	63.3*	<0.005
<i>N,N'</i> -ジ-第三-ブチル- <i>N,N'</i> -ビス-(6-エトキシカルボニル-ヘキサノイル)-エチレンジアミン	134	10	60.3*	<0.005
ジエチル酢酸 <i>N,N'</i> -ビス-(1,3-ジエチル-アセトアミノ)-ブロビルエスチル	187	10	46.4*	<0.005
<i>N,N'</i> -ビス-(β-ドテカノイロキシエチル)- <i>N,N'</i> -ビス-(ドテカノイル)-エチレンジアミン	188	10	43.4*	<0.005
<i>N,N'</i> -ビス-(ジエチルアセチル)-1,3-ジアミノ-ブロバン-2-オール	60	10	72.7*	<0.05
<i>N,N'</i> -ビス-(デカノイル)-2-アミノメチル-ビペリジン	195	10	53.9*	<0.005

* 低下した増加(非処理対照物=100%)

第1表吸き

<i>N,N'</i> -ビス-(10-ウンテカノイル)-2-アミノメチル-ペペリジン	191	10	57.4*	<0.005
<i>N,N'</i> -ビス-(ドテカノイル)- <i>N,N'</i> -ビス-(1-エトキシ-カルボニルエチル)-トリメチレンジアミン	181	10	70.8*	<0.05
<i>N,N'</i> -ビス-(デカノイル)- <i>N,N'</i> -ビス-(1-ヒドロキシ-カルボニルエチル)-トリメチレンジアミン	182	10	67.8*	<0.05
<i>N,N'</i> -ビス-(ドテカノイル-N-(β-ドテカノイロキシ-エチル)-エチレンジアミン	188	10	38.2*	<0.005
<i>N,N'</i> -ジエチル- <i>N,N'</i> -ビス-(10-ウンデセノイル)-エチレンジアミン	126	10	38.2*	<0.005
<i>N,N'</i> -ジエチル- <i>N,N'</i> -ビス(ドテカノイル)-エチレンジアミン	175	10	24.1*	<0.001
<i>N,N'</i> -ジエチル- <i>N,N'</i> -ビス-(デカノイル)-エチレンジアミン	127	10	30.1*	<0.001
<i>N,N'</i> -ビス-(デカノイル)-1-オルニチン-メチルエステル	51	10	44.8*	<0.02
<i>N,N'</i> -ビス-(10-ウンデセノイル)-イソブチレン-1,2-ジアミン	16	10	27.1*	<0.001

* 低下した増加(非処理対照物=100%)

第1表吸き

<i>N,N'</i> -ジメチル- <i>N,N'</i> -ビス-(デカノイル)-エチレンジアミン	93	10	42.4*	<0.005
<i>N,N'</i> -ジメチル- <i>N,N'</i> -(ウンデセノイル)-エチレンジアミン	94	10	63.1*	<0.05
<i>N</i> -(2-クロロフェニル)- <i>N,N'</i> -(10-ウンデセノイル)-エチレンジアミン	78	10	59.4*	<0.005
<i>N</i> -(2-トリル)- <i>N,N'</i> -ビス-(10-ウンデセノイル)-エチレンジアミン	80	10	59.4*	<0.05
<i>N,N'</i> -ジエチル- <i>N,N'</i> -ビス-(ウンテカノイル)-エチレンジアミン	124	10	40.4*	<0.001
<i>N</i> -フェニル- <i>N,N'</i> -ビス-[2-(10-ウンデセノイルアミノ)-エタン]	45	10**	46.5*	<0.005
<i>N,N'</i> -ビス-[4-(<i>N</i> -ベンゾイルアミノ)-ブチリル]- <i>N,N'</i> -ジノバレリル-エチレンジアミン	143	30**	23.4*	<0.001
<i>N,N'</i> -ビス(9-ウンデセノイル)-プロピレンジアミン	13	30**	44.1*	<0.005
<i>N,N'</i> -ビス-(9-ウンデセノイル)-2,5-ジメチル-ビペラジン	167	10** 30**	26.8* 24.2*	<0.005 <0.001
<i>N,N'</i> -ビス-(オクテロキシアセチル)-ビペラジン	168	30**	52.7*	<0.025
<i>N,N'</i> -ビス-(オクテロキシアセチル)-フロビレンジアミン	14	30**	38.3*	<0.05

* 低下した増加(非処理対照物=100%)

** 投与量は1回のみで投与した。

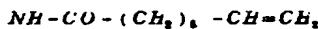
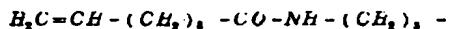
第1段から、本発明による化合物は、血清トリグリセリド濃度のか大を著るしく低下させることを見ることができる。

ここに挙げた化合物は、きわめて低い毒性によりて立つていて、LD₅₀は、はつかねずみに対する一回の経口投与に対して、2,000mg/kgよりも大である。

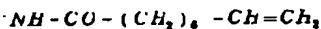
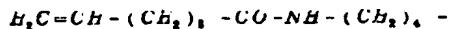
実施例 1

N,N'-ビス-(10-ウンデセノイル)-ト

リメチレンジアミン



3.7g(0.05モル)の1,3-ジアミノブタン、11.1g(0.11モル)のトリエチルアミンおよび200mlの無水テトラヒドロフランの浴



実施例1に記した本発明の方法に従つて、無水テトラヒドロフラン中の4.4g(0.05モル)の1,4-ジアミノブタン、11.1g(0.11モル)のトリエチルアミンおよび22.3g(0.11モル)のウンデシレン塩クロリドから、これを調製した。

収量：17.2g(82%)。

融点：139～140℃(アセトニトリル)

分析：C₂₂H₄₄N₂O₂(420.5)

計算値 C 74.3 H 11.5 N 6.6

測定値 C 74.0 H 11.7 N 6.8

実施例 3

N,N'-ビス-(ドテカノイル)-プロピレン

ジアミン

液を5℃に冷却した。30mlの無水テトラヒドロフラン中の22.3g(0.11モル)のウンデシレン塩クロリドを、搅拌および氷による冷却下に、滴下し、混合物を室温に至らしめ且つ60℃において、さらに2時間搅拌した。反応混合物を水中に注ぎ且つ固体生成物を浮別したのち、エタノール/アセトニトリルから再結晶した。

収量：17.2g(84%)、融点：112～113℃。

分析：C₂₂H₄₄N₂O₂(406.5)

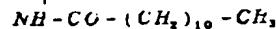
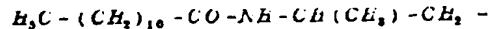
計算値 C 73.9 H 11.4 N 6.8 O 7.8

測定値 C 73.5 H 11.0 N 6.8 O 7.5

実施例 2

N,N'-ビス-(10-ウンデセノイル)-テ

トメチレンジアミン



24.1g(0.11モル)のドテカノイルクロリドを、氷で冷却しながら、3.7g(0.05モル)のプロピレンジアミン、11.2g(0.11モル)のトリエチルアミンおよび100mlの無水テトラヒドロフランからなる浴液に於して滴下した。搅拌を終夜継続したのち、混合物を、さらに2時間、60℃に加熱した。冷却後、水を加え、沈殿した生成物を浮別し、既にエタールから2回再結晶した。

収量：14.1g(64.4%)

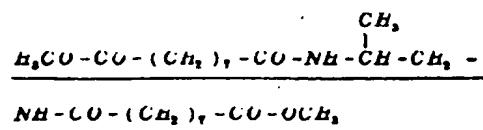
融点：119～120℃

分析：C₂₂H₄₄N₂O₂(438.7)

計算値 C 73.9 H 12.3 N 6.38

測定値 C 73.6 H 12.0 N 6.2

実施例 4

N,N'-ビス-(8-メトキシカルボニル-オクタノイル)-プロピレンジアミン

これは、実施例3と同じにして、24.2% (0.11モル) の8-クロロホルミルオクタン酸メチルエステルと共に無水テトラヒドロフラン中の3.7% (0.05モル) のプロピレンジアミンおよび11.2% (0.11モル) のトリエチルアミンを用いて、調製した。

収量：9.6% (43.4g)、沸点104~106°C

分析： $C_{12}H_{14}N_2O_4$ (442.6)

計算値 C 62.5 H 9.5 N 6.3

測定値 C 62.7 H 9.2 N 6.3

実施例 5~14：(第2表)

10.1% (0.1モル) のトリエチルアミンを、15.0mlの無水ジメチルホルムアミド中の、下表に示すカルボン酸0.1モルの攪拌溶液に対して加え、混合物を-10°Cまで冷却し、この温度において、10.8% (0.1モル) のクロロキ酸エチルエステルを、攪拌下に、滴下した。混合物を-10°Cにおいてさらに30分間攪拌し、次いで5.0mlの無水ジメチルホルムアミド中の3.7% (0.05モル) のプロピレンジアミンを滴下した。この混合物を一夜室温で放置し、次いで60°Cにおいてさらに2時間攪拌したのち、冷却した。反応混合物を5.0mlの水中に注下し、固体生成物を沈退したのち、再結晶した。

第2表

カルボン酸とプロピレンジアミンとの反応
($H_3N-CH_2-CH_2-NH_2 + 2 B-COOH \rightarrow b-CO-NH-CH_2-CH_2-NH-CO-B$)

実施例	カルボン酸 ($B-COOH$)	収率	沸点 (再結晶溶剤)	組成式 (分子量)	分析			
5	$H_3C-(CH_2)_7-S-CH_2-COOH$	28%	83~84° (リグロイン)	$C_{12}H_{16}N_2O_3S_2$ (446.8)	計算値 C 61.5 H 10.4 N 6.27 S 14.4	測定値 C 61.5 H 10.4 N 6.5 S 14.4		
6	$H_3C-(CH_2)_7-SO-CH_2-COOH$	30.5%	120° (リグロイン)	$C_{12}H_{16}N_2O_3S_2$ (478.8)	計算値 C 57.7 H 9.68 N 5.85 S 13.4	測定値 C 58.0 H 9.4 N 6.0 S 13.1		
7	$H_3C-(CH_2)_7-SO_2-CH_2-COOH$	32%	140° (メタノール)	$C_{12}H_{16}N_2O_4S_2$ (510.8)	計算値 C 54.1 H 9.09 N 5.48 S 12.6	測定値 C 54.1 H 9.4 N 5.6 S 12.7		
8	$H_3C-CH_2-O-CO-(CH_2)_8-COOH$	28.2%	105~110° (酢酸エチル)	$C_{12}H_{16}N_2O_4$ (357.4)	計算値 C 57.0 H 8.4 N 7.8	測定値 C 56.8 H 8.5 N 8.0		
9	$\text{C}_6\text{H}_5-NH-CO-(CH_2)_8-COOH$	40.4%	188° (エタノール)	$C_{13}H_{14}N_2O_4$ (592.7)	計算値 C 70.9 H 8.8 N 9.4	測定値 C 70.8 H 8.6 N 9.1		
10	$\text{C}_6\text{H}_5-\overset{CH_3}{N}-CO-(CH_2)_8-COOH$	19.6%	140° (アセトニトリル)	$C_{13}H_{14}N_2O_4$ (480.6)	計算値 C 67.5 H 7.6 N 11.65	測定値 C 67.3 H 7.6 N 11.4		
11	$H_3N-CO-(CH_2)_7-COOH$	32.3%	169~172° (水)	$C_{11}H_{14}N_2O_4$ (412.6)	計算値 C 61.1 H 9.8 N 13.6	測定値 C 61.0 H 10.1 N 13.5		
12	$H_3C-(CH_2)_7-CH=CH-COOH$	50%	130~132° (アセトニトリル)	$C_{12}H_{16}N_2O_2$ (406.5)	計算値 C 73.8 H 11.4 N 6.9	測定値 C 73.6 H 11.0 N 6.76		

第2表紙

実施例	カルボン酸 ($B-COOH$)	取率 (%)	融点 (色融点をもと) (リグロイン)	組成式 (分子量)	分析		
					計算値	測定値	差
13	$H_3C-CH-CH-(CH_2)_7-COOH$	81%	103-104°	$C_{23}H_{44}N_2O_4$ (406.5)	C 73.0 H 11.4 N 6.9	C 73.6 H 11.2 N 6.8	-0.6
14	$H_3C-(CH_2)_7-O-CH_2-COOH$	53%	38°	$C_{23}H_{44}N_2O_4$ (414.5)	計算値 C 66.7 H 11.2 N 6.7	測定値 C 66.8 H 11.2 N 6.4	-0.1

実施例 15

N, N' - ビス - (9 - カルボキシカルボニル -
ノナノイル) - プロピレンジアミン

$$H_3C_2O-CO-(CH_2)_8-CO-NH-$$

$$CH_3$$

$$|$$

$$CH-CH_2-NH-CO-(CH_2)_8-CO-OC_2H_5$$

24.9% (0.1モル) の 9 - クロロホルミル -
ノナン酸エチルエステルを、3.7% (0.05モル)
のプロピレンジアミン、10.1% (0.1モル) の
トリエチルアミンおよび20.0mLの酢酸エチルの
攪拌浴液に加えて、氷で冷却しながら、滴下した。
終夜攪拌したのち、混合物を50°Cで2時間攪拌
し、氷水中に注下したのち、有機相を分離した。
水洗および乾燥 (Na_2SO_4) 後、溶剤を留去し、
残渣をアセトニトリルから再結晶した。

収率 19.0% (82%)、融点 118-120°C

分析: $C_{27}H_{48}N_2O_4$ (498.7)

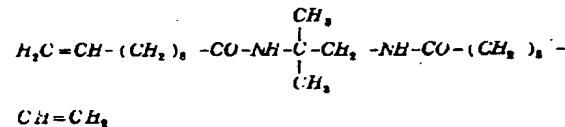
計算値 N 5.6

測定値 N 5.4

実施例 16

1, 1 - ジメチル - N, N' - ビス - (10 -

ウントセノイル) - エチレンジアミン



18.4% (0.1モル) のウントシレン酸を約
20.0mLの無水テトラヒドロフラン中に溶解した。
10.1% (0.1モル) のトリエチルアミンの添加
後、混合物を-10°Cに冷却し且つ10.8%
(0.1モル) のクロロギ酸エチルエステルを滴下

した。さらに1時間搅拌したのち、30mlの無水テトラヒドロフラン中の5.0g(0.05モル)の1,1-ジメチルエチレンジアミンを-10°Cにおいて注下した。混合物を絶対温度で放置したのち、500mlの氷水中に注いだ。反応混合物をクロロホルムによる抽出によつて処理し、クロロホルム溶液を水洗したのち、有機を留去した。中性の酸化アルミニウム上のクロマトグラフィーおよび石油エーテルによる洗出後に、生成物を石油エーテル(沸点60~100°C)から再結晶した。

収量: 9.5g(45.3%), 溶点44~45°C。

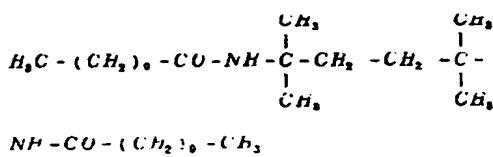
分析: C₂₀H₄₀N₂O₂(420.5)

計算値: C 74.4 H 11.5 N 6.6

測定値: C 74.7 H 11.4 N 6.5

実施例 17

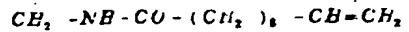
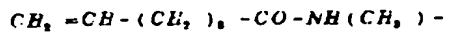
2,5-ジメチル-N,N'-ビス-(ウンデカノイル)-2,5-ジアミノヘキサン



18.6g(0.1モル)のウンデカノイルクロリドを150mlの無水テトラヒドロフラン中の7.2g(0.05モル)の2,5-ジメチル-2,5-ジアミノヘキサンおよび10.1g(0.1モル)のトリエチルアミンに対して、氷で冷却しながら、滴下した。混合物を室温となるまで放置したのち、さらに1時間40°Cに加熱し、冷却後、500mlの氷水中に注下した。白色沈殿を过滤し、水洗したのち、酢酸エチルから再結晶した。

N,N'-ビス-(10-ウンデセノイル)-アブ

ロビレンジアミン



これは、実施例16と同様にして、18.4g(0.1モル)のウンデシレンジ、10.1g(0.1モル)のトリエチルアミン、10.8g(0.1モル)のクロロキルエチルエステルおよび3.7gの1,2-ジアミノプロパンから合成した。

収量: 17.0g(84%)、融点105~106°C(アセトニトリル)。

分析: C₂₃H₄₆N₂O₂(406.5)

計算値: C 73.9 H 11.4 N 6.8

測定値: C 73.9 H 11.1 N 6.4

実施例 18

収量: 20g(42%)、融点113~115°C

分析: C₂₃H₄₆N₂O₂(406.5)

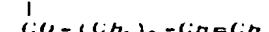
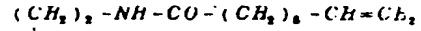
計算値: C 75.1 H 12.6 N 5.84

測定値: C 75.2 H 12.7 N 5.4

実施例 19

N,N',N"-トリス-(10-ウンデセノイル)-

-ジエチレントリアミン



これは、実施例18と同様にして、テトラヒドロフラン中の18.4g(0.1モル)のウンデシレンジ、10.2g(0.1モル)のトリエチルアミン、10.8g(0.1モル)のクロロキルエチルエステルおよび3.3g(0.33モル)のジエチレントリアミンから合成した。

収量：11.0 g (55.7%), 融点70~73°C.
(アセトニトリル)

分析：C₅H₁₀N₂O₂ (C 60.1%)

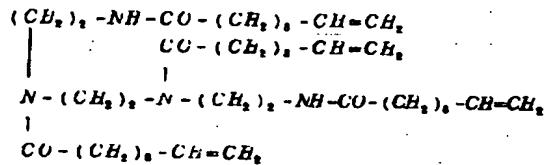
計算値 C 73.8 H 11.2 N 7.0 O 8.0

測定値 C 74.1 H 10.8 N 6.6 O 7.9

実施例 20

N, N', N'', N'''-テトラ-(10-ウンデ

セノイル)-トリエチレンテトラミン



26.2 g (0.13モル)のウンデシレン酸クロリドを、200 mlの無水テトラヒドロフラン中の4.3 g (0.03モル)のトリエチレンジアミンお

3.8 g (0.2モル)のテトラエチレンベンタミンおよび10.1 g (0.1モル)のトリエチルアミンを、200 mlの無水テトラヒドロフラン中に溶解した。冰で冷却し且つ攪拌しながら、19.0 g (0.1モル)のカブリン酸クロリドを滴下した。終夜攪拌したのち、水中に注下し、混合物をエーテルで抽出し且つエーテル溶液を水洗し、且つ乾燥した(Na₂SO₄)。溶剤を留去して乾固させたのち、生成物をアセトニトリルおよびメタノールから再結晶した。

収量：10.5 g (54.7%), 融点113~115°C

分析：C₁₃H₂₂N₂O₂ (96.1%)

計算値： C 72.6 H 11.7 N 7.25

測定値： C 72.2 H 11.6 N 7.5

実施例 22

特開昭51-127002 (30)
より13.1 g (0.13モル)のトリエチルアミン
に、氷で冷却しながら、滴下した。終夜放置した
のち、混合物を水中に注下し、生成物を过滤した
のち、アルコールからおよびアセトニトリルから
再結晶した。

収量：11.0 g (45.8%), 融点136~137°C.

分析：C₁₆H₂₂N₂O₂ (81.1%)

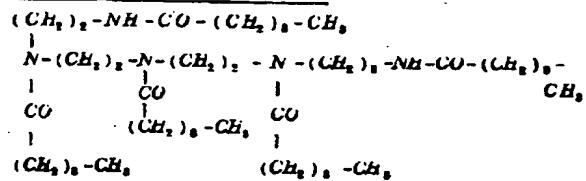
計算値 C 74.0 H 11.2 N 6.9

測定値 C 74.5 H 11.1 N 6.5

実施例 21

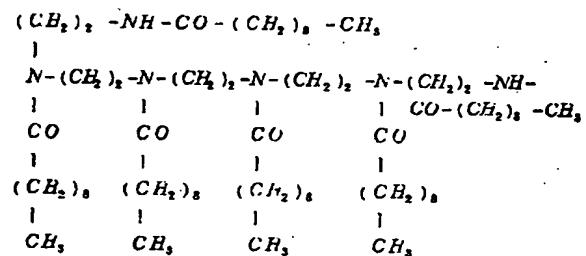
N, N', N'', N''', N'''-ペンタデカノイル

-テトラエチレンベンタミン



N, N', N'', N''', N''''-ヘキサデカ

ノイル-ペンタエチレンヘキサミン



10.1 g (0.1モル)のトリエチルアミンおよび3.7 g (0.016モル)のペンタエチレンヘキサミンを200 mlの無水テトラヒドロフランに加えたのち、19.0 g (0.1モル)のデカン酸クロリドを、攪拌し且つ氷で冷却しながら、滴下した。終夜放置したのち、混合物を500 mlの水中に注ぎ、且つエーテルで抽出し、エーテル溶液を水洗し且つ乾燥(Na₂SO₄)した。エーテルの留去後に、

生成物を酢酸エチルから再結晶した。

収率：8.5% (45.8g)、融点137~138℃

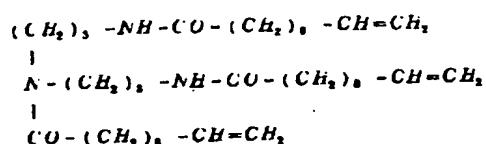
分析：C₁₀H₁₃N₂O₂ (115.7.9)

計算値 N 7.3

測定値 N 7.4

実施例 23

N, N', N'' -トリス-(10-ウンデセノイルアミノメチル)-[ビス-(3-アミノプロピル)-アミン]



合成は、実施例18と同様にして、150mlの無水テトラヒドロフラン中の20.2g (0.1モル) の3,3'-ジアミノジプロピルアミンおよび10.1g (0.1モル) のトリエチルアミンを使用

のクロロギ酸エチルエステルおよび5.7g (0.05モル) の1,2-ビス-(アミノエチル)-シクロブタンから出来て合成した。

収率：14.4g (65%)、融点74~77℃。

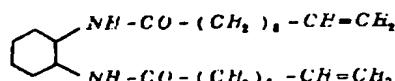
分析：C₂₈H₅₀N₂O₂ (446.7)

計算値 C 75.4 H 11.3 N 6.2

測定値 C 75.8 H 11.6 N 6.0

実施例 25

N, N' -ビス-(10-ウンデセノイル)-シクロヘキサン1,2-ジアミンのシス/トランス混合物



これは、無水テトラヒドロフラン中の18.4g (0.1モル) のウンデシレン基、10.1g (0.1

して行なつた。

収率：16.0% (84.7g)、融点64~65℃

(リグロインから2回再結晶)。

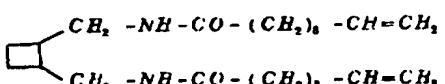
分析：C₂₈H₄₈N₂O₂ (629.9)

計算値 C 74.5 H 11.3 N 6.6 O 7.6

測定値 C 74.1 H 11.4 N 6.4 O 7.5

実施例 24

1, 2 - ビス-(10-ウンデセノイルアミノメチル)-シクロブタン



これは、実施例16と同様にして、無水テトラヒドロフラン(アセトニトリル)中の18.4g (0.1モル) のウンデシレン基、10.1g (0.1モル) のトリエチルアミン、10.8g (0.1モル)

モル) のトリエチルアミン、10.8g (0.1モル)

のクロロギ酸エチルエステルおよび4.7g (0.05モル) の1,2-ジアミノシクロヘキサンのシス/トランス混合物を併用して、実施例16と同様にして合成すること可能であつた。

収率：10.3% (46.3%)、融点139~140℃(アセトニトリル)。

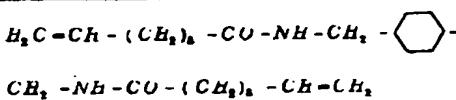
分析：C₂₈H₅₀N₂O₂ (446.6)

計算値 C 75.4 H 11.2 N 6.2 O 7.1

測定値 C 75.2 H 11.6 N 6.2 O 7.4

実施例 26

N, N' -ビス-(10-ウンデセノイルアミノメチル)-シクロヘキサン



これは、実施例 1 に記した方法に従つて、

150 ml の無水テトラヒドロフラン中の 1.8.4 g
(0.1モル) のウンデシレンジ、1.0.1 g (0.1
モル) のトリエチルアミンおよび 1.0.8 g (0.1
モル) のクロロギド・エチルエステルと共に 7 g
(0.05モル) の 4,4'-ビス-(アミノメチ
ル)-シクロヘキサンを作用して合成了。

収量：8.6 g (36.2%)、融点 174~175°C
(アセトニトリル/アルコール 2:1 およびメタ
ノールから再结晶した)。

分析：C₃₀H₅₆N₂O₂ (474.7)

計算値 N 5.9 O 6.7

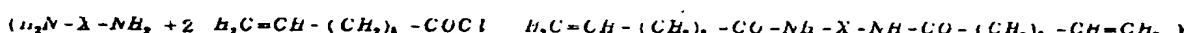
測定値 N 6.0 O 6.9

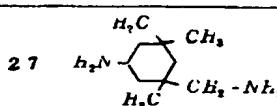
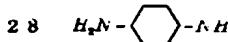
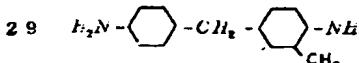
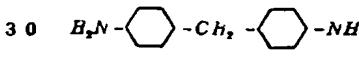
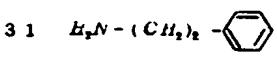
実験例 27~43 (第3表)

これらの化合物は、実施例 1 の記述と同様にし

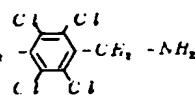
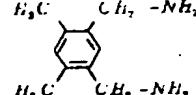
て、150 ml の無水テトラヒドロフラン中の
0.05モルのジアミンおよび 1.1.1 g (0.11モ
ル) のトリエチルアミンから出発し、2.2.3 g
(0.11モル) のウンデシレンジ・クロリドとの反
応により合成了。

第3表：ジアミンとウンデシレンジ・クロリドとの反応

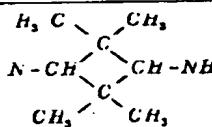


実施例	ジアミン (H ₂ N-X-NH ₂)	収量	融点	元素式 (分析結果) (分子量)	分 子 式
27		15.0 g (6.0%)	78~80° (リグロイン)	C ₂₂ H ₂₈ N ₂ O ₂ (502.7)	計算値 C 76.5 H 11.7 N 5.5 O 6.3 測定値 C 76.6 H 11.5 N 5.3 O 6.2
28		16.0 g (71.7%)	240~242° (エタノール)	C ₁₂ H ₂₀ N ₂ O ₂ (446.6)	計算値 C 75.4 H 11.2 N 6.3 O 7.2 測定値 C 75.1 H 11.1 N 6.2 O 7.3
29		11.0 g (38.7%)	228~232° (メタノール)	C ₂₁ H ₂₆ N ₂ O ₂ (570.9)	計算値 C 77.9 H 11.7 N 4.8 O 5.6 測定値 C 77.7 H 11.3 N 4.7 O 5.4
30		16.0 g (59.3%)	208~209° (エタノール)	C ₂₂ H ₂₈ N ₂ O ₂ (542.7)	計算値 N 5.1 O 5.9 測定値 N 5.0 O 5.6
31		10.0 g (6.4%)	174~175° (エタノール)	C ₃₂ H ₄₄ N ₂ O ₂ (496.7)	計算値 C 77.4 H 10.5 N 5.6 O 6.4 測定値 C 77.2 H 10.6 N 5.4 O 6.1

第3表粉末

実施例	ジアミン ($H_2N-X-NH_2$)	収量	融点 (再結晶溶剤)	組成式 (分子量)	分析
3.2		25.0g (8.3%)	218-221° (n-ブタノール)	$C_{10}H_{14}Cl_2N_2O_2$ 計算値C 59.4 (60.64) 測定値C 59.2 H 7.3 Cl 23.4 N 4.6	
3.3		12.0g (5.0%)	168-170° (エタノールおよび 酢酸エチル)	$C_{12}H_{16}N_2O_2$ 計算値N 5.6 (49.67) 測定値N 5.6	
3.4	$H_2N-(CH_2)_2-\text{C}_6\text{H}_4-NH_2$	16.1g (6.8%)	153-156° (エタノール)	$C_{10}H_{14}N_2O_2$ 計算値C 77.4 (46.87) 測定値C 77.3 H 10.3 N 6.9 O 6.8	
3.5	$H_2N-(CH_2)_2-\text{C}_6\text{H}_4-NH_2$	21.0g (8.7%)	127° (エタノール)	$C_{10}H_{14}N_2O_2$ 計算値C 77.1 H 10.4 N 4.8 O 5.5 (48.28) 測定値C 76.9 H 10.4 N 5.0 O 5.8	
3.6	$(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-NH_2$ $\quad \quad $ $\quad \quad NH_2$	10.0g (3.74%)	90-91° (エタノール)	$C_{10}H_{16}N_2O_4$ 計算値C 71.7 H 11.2 N 5.2 (53.67) 測定値C 71.6 H 11.8 N 4.9	
3.7	$(CH_2)_2-S-(CH_2)_2-S-(CH_2)_2$ $\quad \quad \quad \quad $ $\quad \quad NH_2 \quad NH_2$	15.0g (5.8%)	110° (エタノール)	$C_{10}H_{16}N_2O_4S_2$ 計算値C 65.5 H 10.5 N 5.4 S 12.4 (51.69) 測定値C 65.6 H 10.6 N 5.3 S 12.0	

第3表粉末

実施例	ジアミン ($H_2N-X-NH_2$)	収量	融点 (再結晶溶剤)	組成式 (分子量)	分析
3.8		10.7g (4.55%)	177-178° (酢酸エチル)	$C_6H_{12}N_2O_2$ 計算値C 76.3 H 11.1 N 5.9 (47.27) 測定値C 76.3 H 11.3 N 5.6	
シス/トランス混合物					
3.9	$H_2N-CH_2-C\equiv C-CH_2-NH_2$	12.4g (6.0%)	137-138° (アセトニトリル/ エタノール)	$C_{10}H_{14}N_2O_2$ 計算値C 75.0 H 10.6 N 6.7 (41.67) 測定値C 75.2 H 10.3 N 6.7	
4.0	$H_2N-CH_2-\text{C}_6\text{H}_4-NH_2$	12.8g (5.7%)	80-82° (メタノール/ アセトニトリル)	$C_{10}H_{14}N_2O_2$ 計算値C 75.3 H 11.3 N 6.3 (44.67) 測定値C 75.2 H 11.5 N 6.0	
4.1	$H_2N-CH_2-\text{C}_6\text{H}_4-NH_2$	14.2g (6.2%)	70-71° (リクロイン)	$C_{10}H_{14}N_2O_2$ 計算値C 75.6 H 11.3 N 6.17 (46.08) 測定値C 75.4 H 11.4 N 5.9	
4.2	$CH_2-\text{C}_6\text{H}_4-S-S-\text{C}_6\text{H}_4-CH_2$ $\quad \quad \quad \quad $ $\quad \quad NH_2 \quad NH_2$	16g (6.62%)	108-109° (エタノール)	$C_{16}H_{16}N_2O_4S_2$ 計算値N 5.8 S 13.2 (48.48) 測定値N 5.6 S 13.2	

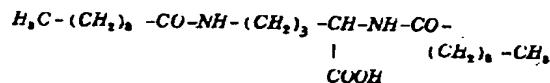
第3表続き

実験例	ジアミン ($H_2N-X-NH_2$)	收率	融点 (再結晶溶剤) (分子量)	分子式	分析
4.3		12.3% (53%)	108-110° (リグロイン)	$C_{10}H_{12}N_2O_2$	計算値 C 76.9 H 10.3 N 5.98 測定値 C 76.4 H 10.5 N 5.8
4.4	$H_2N-(CH_2)_2-S-(CH_2)_2-NH_2$	20.7%	118°	$C_{20}H_{44}N_2O_2S$	計算値 C 69.1 H 10.6 N 6.2 S 7.0 測定値 C 68.9 H 10.9 N 5.8 S 7.3
4.5	$H_2C_6-N(CH_2-CH_2-NH_2)_2$	15.9%	77°	$C_{22}H_{32}N_2O_2$	計算値 C 75.1 H 10.4 N 8.3 測定値 C 75.2 H 10.2 N 8.2

実施例 4.6

 N, N' -ビス-(デカノイル)-D,L-オル

ニチ



20.9 (0.5モル)の水酸化ナトリウムおよび16.9g (0.1モル)のD,L-オルニチンモノ塩酸塩を、20.0mlのエーテル、100mlのベンゼンおよび20.0mlの水の混合物に加えた。よく搅拌し且つ冷却しながら、38.0g (0.2モル)のカフリン酸クロリドを滴下し、その間温度を0°Cに保つた。混合物を搅拌しながら室温とし、塩酸を用いて酸性としたのち、有機相を分離した。水洗後、乾燥するまで蒸縮し、生成物をベンゼンから再結晶して38g (86.5%)を得た。

融点 125~127°C

分析: $C_{18}H_{44}N_2O_4$ (440.7)

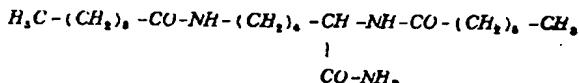
計算値: C 68.1 H 11.9 N 6.34

測定値: C 68.2 H 11.6 N 6.4

実施例 4.7

 N, N' -ビス-(デカノイル)-L-リジン-

アミド

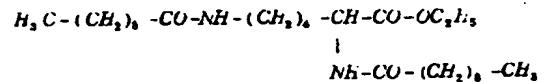


150mlの無水ジメチルホルムアミド中の10.9g (0.05モル)のL-リジン-アミド・2HClを、約0°Cに冷却した。次いで20.2g (0.2モル)のトリエチルアミンを加えたのち、19.0g (0.1モル)のデカニ酸クロリドを滴下した。混合物を室温にして終夜放置したのち、500mlの

計算値: C 7 1.4 H 1.4 N 8.0 O 9.2

測定値: C 7 1.2 H 1.5 N 7.8 O 9.4

実施例 49

N,N'-ビス-(デカノイル)-L-リジンエチルエステル

1 2.4 g (0.05モル)のL-リジンエチルエ

ステル・2HClを、120 mlのジメチルホルムアミド中に溶解した。20.2 g (0.2モル)のトリエチルアミンの添加後、混合物を冰水によつて約5°Cまで冷却し且つこの温度で19 g (0.1モル)のカブリン塩クロリドを落下した。混合物を終夜室温で放置し、次いで40°Cに短時間(0.5時間)加温し、冷却したのち水中に注いだ。粗略エチル

水中に注ぎ、液体生成物を沪過して再結晶した。

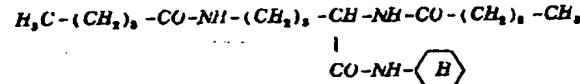
融点176°C、収量12.9g (56.5%)。

分析: C₁₆H₂₂N₂O₂ (457.7)

計算値 C 6 8.9 H 1 1.3 N 9.2

測定値 C 6 8.8 H 1 0.9 N 9.2

実施例 48

N,N'-ビス-(デカノイル)-D,L-オルニテン-シクロヘキシリアミド

これは、14.2 g (0.05モル)のD,L-オルニテン-シクロヘキシリアミド・2HClを使用して、実施例47と同様にして合成した。融点157~158°C、収量15.2g (58%)。

分析: C₂₁H₃₂N₂O₂ (521.7)

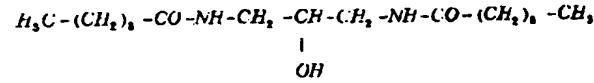
からの2回の再結晶は、65.5g (68%)を与えた、融点89~90°C。

分析: C₂₁H₃₄N₂O₂ (482.7)

計算値 C 6 9.8 H 1 1.3 N 5.8

測定値 C 6 9.2 H 1 1.2 N 5.8

実施例 50

N,N'-ビス-(デカノイル)-1,3-ジアミノ-2-ヒドロキシプロパン

9.5 g (0.5モル)のカブリン塩クロリドを、500 mlの無水テトラヒドロフラン中の22.5 g (0.25モル)の1,3-ジアミノ-2-ヒドロキシプロパンおよび51 g (0.5モル)のトリエチルアミンの氷冷した溶液中に滴下した。混合物

を搅拌しながら室温に至らしめたのち、700 mlの水中に注ぎ、沈殿した固体生成物を沪過した。

水で洗つたのち、エタノールから再結晶し、

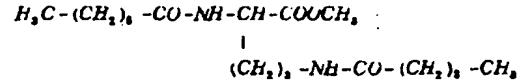
75.7 g (76%)を取得した。融点130~131°C。

分析: C₂₁H₃₆N₂O₂ (398.6)

計算値 C 6 9.2 H 1 1.6 N 7.0 O 1 2.0

測定値 C 6 9.5 H 1 1.4 N 6.9 O 1 2.4

実施例 51

N,N'-ビス-(デカノイル)-L-オルニチンメチルエステル

10.9 g (0.05モル)のL-オルニチンメチルエステル二塩酸化物および20.2 g (0.2モル)

のトリエチルアミンを、200 ml の無水テトラヒドロフラン中に加えた。この混合物を0℃に冷却し且つ19.9 (0.1モル) のカブリン酸クロリドを落下した。混合物を室温となるまで放置したのち、さらに4時間50℃に加温し、水中に注ぎ且つ沈過した。白色結晶をリクロインから再結晶した。

収量：12.5 g (55.2%)、融点79~82℃。

分析 $C_{20}H_{30}N_2O_2$ (454.5)

計算値 C 68.8 H 11.0 N 6.1

測定値 C 68.8 H 11.0 N 5.8

実施例 52

N, N' -ビス-(10-ウンデカノイル)-L-

-リジンエチルエステル

(2:1) から得ました。

収量：12.5 g (50%)、融点69~71℃。

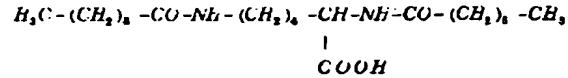
分析 $C_{30}H_{34}N_2O_4$ (506.6)

計算値 C 71.1 H 10.7 N 5.5

測定値 C 70.9 H 10.7 N 5.8

実施例 53

N, N' -ビス-(テカノイル)-L-リジン



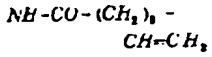
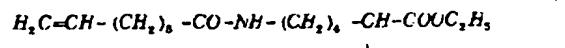
これは、18.27 g (0.1モル) のL-リジン・一塩酸化物を使用して、実施例46と同様にして調製した。

収量：36.2 g (80%)、融点104~105℃。

分析 $C_{20}H_{30}N_2O_4$ (454.7)

計算値 C 68.8 H 11.1 N 6.1

測定値 C 68.7 H 11.4 N 6.5



18.4 g (0.1モル) の10-ウンデセン酸を、

200 ml の無水テトラヒドロフラン中に溶解した。

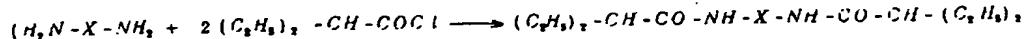
20.2 g (0.2モル) のトリエチルアミンの添加後、混合物を-10℃まで冷却し且つ、この温度において、10.8 g (0.1モル) のクロロギリカルエスチルを、攪拌しながら、落下した。混合物を-10℃において、さらに20分攪拌し、次いで80 ml の無水テトラヒドロフラン中に溶解した12.4 g (0.05モル) のL-リジンエチルエステル二塩酸化物を落下した。混合物を終夜室温で放置し、次いで60℃でさらに4時間攪拌したのち、水中に注いだ。沈殿した生成物を汎過し、アセトニトリルおよび石油エーテル/酢酸エチル

実施例 54~59(第4表)

第4表に示す化合物は、実施例18に記した方法に従つて、150 ml の無水テトラヒドロフラン中の0.05モルのジアミンおよび10.1 g (0.1モル) のトリエチルアミンならびに13.05 g (0.1モル) のジエチル酰酸クロリドから出発して、調製した。

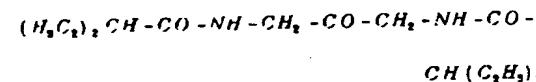
実施例56は0.02モルのジアミンおよび相当する量のトリエチルアミンならびにジエチル酰酸クロリドを使用して合成した。

実験 4：ジアミンのジエチル酢酸クロリドとの反応



実験例	ジアミン ($H_2N-X-NH_2$)	収量	融点 (再結晶溶剤)	構造式 (分子量)	分析	
5.4		12.1%	178-181° (アセトニトリル)	$C_{10}H_{20}N_2O_2$ (81.05)	計算値 測定値	C 69.7 H 11.0 N 9.1 C 70.0 H 11.0 N 9.1
5.5		9.5%	161-162° (5.9%) (トルエン/リグロイン)	$C_{10}H_{20}N_2O_2$ (324.5)	計算値 測定値	C 70.4 H 11.2 N 8.6 C 70.8 H 11.4 N 8.2
5.6		13.2%	210-212° (7.9%) (アセトニトリル)	$C_{12}H_{20}N_2O_2$ (88.2.5)	計算値 測定値	C 72.8 H 9.7 N 8.48 C 72.2 H 9.8 N 8.7
5.7		3.8%	120° (5.4%) (アセトニトリル)	$C_{11}H_{20}N_2O_2S$ (87.8.6)	計算値 測定値	N 7.4 S 8.4 N 7.1 S 8.0
5.8	$H_2C_6-N(CH_2-CH_2-NH_2)_2-S-C_2H_5$	14.0%	179-180° (7.8%) (アセトニトリル)	$C_{12}H_{22}N_2O_2$ (87.3.4)	計算値 測定値	C 70.8 H 9.5 N 11.2 C 71.0 H 9.7 N 11.3
5.9	$HO-CH(CH_2-CH_2-NH_2)_2$	26.0%	171-172° (8.5%) (リグロイン/アセトニトリル)	$C_{12}H_{20}N_2O_3$ (284.4)	計算値 測定値	N 9.8 N 9.9

実験 6.0

 N,N' -ビス-(ジエチルアセチル)-1,8-ジアミノ-プロパン-2-オン

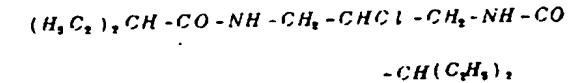
3.22g (0.02モル) の 1,8-ジアミノ-
プロパン-2-オン二塩酸化物を 100ml の水中
溶解させた。100ml の塩化メチレンの添加後、
混合物を約0.1hで冷却し且つ1NのNaOH水溶液
へとびが5.0ml のクロロホルム中の5.2g (0.04
モル) のジエチル酢酸クロリドを、水溶液が体温
中までとどまるようを混合して、同時に落下した。
重浮しきがら、反応混合物が体温でなつたのち、
クロロホルム層を分離し、水洗しきのち、ロータ
リー-エバボレーター中で乾燥するまで蒸留した。

残渣を作成エチルへとびりグロイシから再結晶し
た。収量: 3.15g (55.5%) ; 融点 168-
170°。

分析: $C_{13}H_{24}N_2O_3$

計算値 C 63.8 H 9.9 N 9.9
測定値 C 63.1 H 9.8 N 9.6

実験 6.1

 N,N' -ビス-(ジエチルアセチル)-1,8-ジアミノ-8-クロロプロパン

これは、3.58g (0.02モル) の 1,8-ジ
アミノ-2-クロロプロパン二塩酸化物から出発
して、実験例 6.0 と同様にして調査した。収量:
4.12g (51%) ; 融点 117-119°。

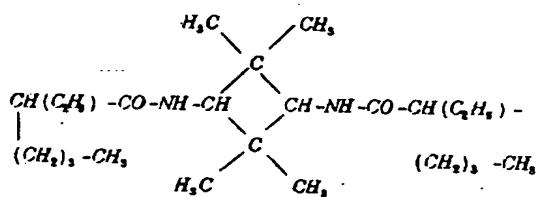
分析: $C_{13}H_{20}ClN_2O_2$ (80.4.9)

計算値 C 59.2 H 9.6 Cl 11.6 N 9.2

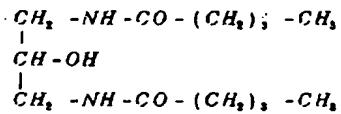
測定値 C 59.8 H 9.7 Cl 11.2 N 9.8

実施例 62

シス-およびトランス- N,N' -ビス-(2-エチル-ヘキサンイル)-1,3-ジアミノ-2,4,4-テトラメチル-シクロブタン



実施例 18 と同様にして、150 ml の無水テトラヒドロフラン中の 7.1 g (0.05 モル) の 1,3-ジアミノ-2,2,4,4-テトラメチル-



8.1.6 g (0.2 モル) の無水硝酸を、100 ml のエーテル中の 9 g (0.1 モル) の 1,2-ジアミノプロパン-2-ナール中に滴下した。24 時間放置後、溶剤を真空中に除去し、200 ml のリグロインを加え、固体生成物を沪過し、アセトニトリルから再結晶した。収量: 15.5 g (60%), 熔点 128~129°。

分析: $C_{13}H_{20}N_2O_3$ (258.8)

計算値 C 57.5 H 9.6 N 12.1

測定値 C 57.8 H 9.5 N 12.1

実施例 64~68 (第 5 表)

5.1 g (0.05 モル) のトリエチルアミンを

特開昭51-127002(G8)

シクロブタン(シス/トランス混合物)を、10.1 g

(0.1 モル)のトリエチルアミンの存在下に、

16.3 g (0.1 モル) の 2-エチルヘキサンヨク

ロリドと反応させた。酢酸エチルからの再結晶

(常用の操作法による) は 2 種の生成物を与えた:

A: 収量 4 g, 熔点 218~216° (トランス生成物)

B: 収量 5.3 g, 熔点 180° (シス生成物)

分析: $C_{14}H_{20}N_2O_2$ (394.7)

計算値 C 72.9 H 11.8 N 7.1

生成物 A: 測定値 C 72.8 H 11.9 N 7.0

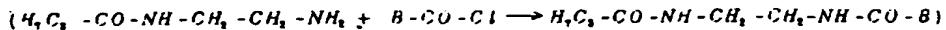
生成物 B: 測定値 C 72.5 H 11.6 N 7.4

実施例 68

N,N' -(n-ブチリル)-1,2-ジアミノ-2-ヒドロキシプロパン

100 ml の無水 $CHCl_3$ 中の 6.5 g (0.05 モル) の N -(n-ブチリル)-エチレンジアミン [ローゼンマント (K. W. Rosenmund), アメリカ合衆国特許 192605 号, ヒエミツシエンツエン・トラルプラット (Chem. Ztbl.) 1938 II, 8616 KC 並びに同上] 中に滴下した。終後攪拌後、溶液を水で洗い、クロロホルムを除去し、残渣を中性の活性アルミニウム上でグロマトグラフィーにかけた。溶離剤としては石油エーテル (沸点 60~100°) を用いた。

第 5 表 : N-ブチリル-エチレンジアミンのオクロリドとの反応



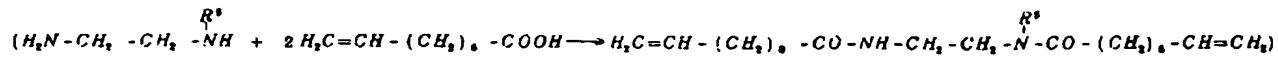
実験番号	オクロリド (B-CO-Cl)	収量	融点 (再結晶溶剤)	経験式 (分子量)	分析				
64	$H_3C=CH-(CH_2)_3-CO-Cl$	12.6g (42.6%)	151-152° (酢酸エチル)	$C_{11}H_{18}N_2O_2$ (296.4)	計算値 測定値	C 68.9 C 68.6	H 10.8 H 10.7	N 9.4 N 9.8	O 10.8 O 11.0
65	$H_3C-(CH_2)_7-CO-Cl$	15.8g (81.2%)	162-168° (酢酸エチル)	$C_{18}H_{30}N_2O_2$ (270.8)	計算値 測定値	C 66.7 C 66.7	H 11.1 H 11.8	N 10.4 N 10.6	
66	$H_3C-(CH_2)_{12}-CO-Cl$	13.8g (77.8%)	162-168° (エタノール)	$C_{25}H_{42}N_2O_2$ (340.5)	計算値 測定値	C 70.6 C 70.9	H 11.8 H 11.9	N 8.2 N 8.2	
67	$H_3C-(CH_2)_3-CH(C_2H_5)CH-CO-Cl$	10.5g (41.6%)	142-148° (酢酸エチル)	$C_{18}H_{30}N_2O_2$ (256.4)	計算値 測定値	C 65.6 C 65.4	H 11.0 H 11.0	N 10.9 N 10.6	O 12.5 O 12.7
68	$H_3C_6-CO-(CH_2)_3-CO-Cl$	11.2g (37.8%)	129-130° (酢酸エチル)	$C_{18}H_{30}N_2O_4$ (300.3)	計算値 測定値	C 60.0 C 60.1	H 9.4 H 9.0	N 9.8 N 9.8	

実験例 69~85 (第 6 表)

1.01g (0.1モル) のトリエチルアミンを
15.0% の塩水テトラヒドロフラン中の 1.8.4g
(0.1モル) のウンデシレン液中に加えた。次い
で混合物を -10° C に冷却し且つ 1.0.8g (0.1
モル) のクロロギリカルエチルエスティルを滴下した。
この混合物を -10°C でさらに 1 時間反応させた
のち、5.0% の塩水テトラヒドロフラン中の、第
6表に示す、N-モノ置換ジアミン 0.05モルを
滴下した。この混合物を減圧において絶夜放置し
その後、5.0% の水中に注下した。固体として
分離した生成物を过滤し且つ再结晶した。油状物
をクロロホルムで抽出した。クロロホルム溶液を
水で洗い且つ水洗をコータリーエバボレーター中
で除去した。次いで中性の炭化アルミニウム上で

クロマトグラフィーを行なつた。溶媒剤として石
油エーテル (沸点 60~100° C) を用いた。

第 6 表 : N-モノ置換ジアミン塩とウンデシレンの反応



実験例	N-モノ置換ジアミン ($H_2N-X-NH-R^a$)	吸量 (%)	融点 (再結晶等刷) n_D^{25}	組成式 (分子量)	分析
6.9	($CH_2)_2-NH-(CH_2)_2-CH_2-NH_2$	10.0 (84.9%)	46-47° (リグロイン)	$C_{27}H_{40}N_2O_2$ (574.9)	計算値 N 4.8 O 5.5 測定値 N 4.7 O 5.5
7.0	($CH_2)_2-NH-(CH_2)_2-CH(CH_3)_2$	8.8 (86.6%)	油: $n_D^{25} 1.4725$	$C_{29}H_{44}N_2O_2$ (462.8)	計算値 C 75.2 H 11.5 N 5.9 O 6.6 測定値 C 75.4 H 11.7 N 5.6 O 6.7
7.1	$H_2N-(CH_2)_2-NH-CH_2-\text{C}_6\text{H}_5$	19.8 (78.7%)	油: $n_D^{25} 1.4903$	$C_{22}H_{38}N_2O_2$ (502.7)	計算値 C 74.5 H 11.6 N 5.6 測定値 C 74.9 H 11.5 N 5.4
7.2	($CH_2)_2-NH-CH_2-CH(C_6H_5)_2-NH_2$	9.0 (87.8%)	油: $n_D^{25} 1.4791$	$C_{30}H_{40}N_2O_2$ (476.7)	計算値 C 75.7 H 11.8 N 5.8 O 6.7 測定値 C 76.0 H 11.7 N 5.8 O 6.8
7.3	($CH_2)_2-NH-CH_2-\text{C}_6\text{H}_5$	10.0 (40%)	油: $n_D^{25} 1.4907$	$C_{22}H_{38}N_2O_2$ (501.9)	計算値 C 76.5 H 11.5 N 5.8 O 6.4 測定値 C 76.0 H 11.8 N 5.6 O 6.8
7.4	($CH_2)_2-NH-CH_2-\text{C}_6\text{H}_5$	18.6 (72%)	47-49° (リグロイン)	$C_{21}H_{40}C_6H_5N_2O_2$ (517.2)	計算値 C 73.4 H 9.5 Cl 6.8 N 5.4 測定値 C 73.4 H 9.8 Cl 6.8 N 5.8

第 6 表 (続)

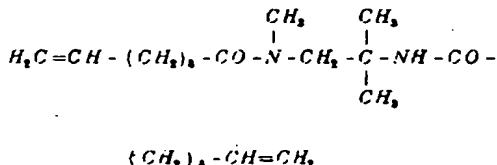
	CH_3					
7.5	($CH_2)_2-NH-CH-(CH_2)_4-CH_3$	9.0 (87.8%)	油: $n_D^{25} 1.4785$	$C_{21}H_{40}N_2O_2$ (490.7)	計算値 C 75.6 H 12.2 N 5.7 O 6.5 測定値 C 75.5 H 12.2 N 5.2 O 6.4	
7.6	$H_2N-(CH_2)_2-NH-C_6H_5$	12.7 (54.8%)	48-49° (アセトニトリル)	$C_{20}H_{38}N_2O_2$ (468.7)	計算値 C 76.8 H 10.8 N 6.0 O 6.8 測定値 C 76.8 H 10.4 N 5.6 O 6.9	
7.7	$H_2N-(CH_2)_2-NH-\text{C}_6\text{H}_5-Cl$	14.4 (55.7%)	65-68° (リグロイン)	$C_{20}H_{37}N_2O_2$ (503.2)	計算値 C 71.6 H 9.4 Cl 7.1 N 5.6 測定値 C 71.8 H 9.5 Cl 6.7 N 5.2	
7.8	$H_2N-(CH_2)_2-NH-\text{C}_6\text{H}_5-Cl$	10.1 (40%)	54-56° (リグロイン)	$C_{20}H_{37}C_6H_5N_2O_2$ (503.2)	計算値 Cl 7.1 N 5.6 O 6.4 測定値 Cl 7.3 N 5.2 O 6.8	
7.9	$H_2N-(CH_2)_2-NH-\text{C}_6\text{H}_5-NO_2$	8.2 (82%)	106-109° (エタノール)	$C_{20}H_{37}N_2O_4$ (513.7)	計算値 N 8.2 測定値 N 8.1	
8.0	$H_2N-(CH_2)_2-NH-\text{C}_6\text{H}_5-CH_3$	8.0 (34.8%)	40-42° (石油エーテル)	$C_{21}H_{40}N_2O_2$ (482.7)	計算値 C 77.8 H 10.8 N 5.8 測定値 C 77.3 H 10.1 N 5.5	
8.1	$H_2N-(CH_2)_2-NH-\text{C}_6\text{H}_5-Cl$	19.4 (60.8%)	48-50° (リグロイン)	$C_{20}H_{37}C_6H_5N_2O_2$ (537.6)	計算値 C 67.6 H 8.8 Cl 13.2 N 5.2 測定値 C 67.5 H 8.6 Cl 13.8 N 5.2	
8.2	$H_2N-(CH_2)_2-NH-(CH_2)_4O-C_6H_5$	6.8 (24.6%)	89-42° (石油エーテル)	$C_{22}H_{42}N_2O_2$ (512.8)	計算値 N 5.5 O 9.4 測定値 N 5.4 O 9.1	

表 6 表 (続)

88	$H_2N-(CH_2)_3-NH-CH_2-C_6H_5$	11.2 g (45%)	47-48° (石油エーテル)	$C_{10}H_{16}N_2O_2$ (496.8)	計算値 測定値	N 5.6 O 6.5 N 5.4 O 6.5
84	$H_2N-(CH_2)_3-NH-CH_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Cl}$	10.0 g (87.8%)	油: $n_D^{25} 1.5050$	$C_{10}H_{16}N_2O_2$ (531.2)	計算値 測定値	C 72.4 H 9.7 Cl 6.7 N 5.8 C 72.1 H 9.6 Cl 6.6 N 5.0
85	$(CH_2)_3-NH-(CH_2)_3-O-C_6H_5$ NH ₂	5.4 g (25%)	35° (石油エーテル)	$C_{10}H_{16}N_2O_2$ (540.8)	計算値 測定値	C 75.8 H 10.4 N 5.1 O 8.9 C 76.2 H 10.3 N 5.1 O 8.6

実施例 86

N, N' - ピス - (10 - ウンデセノイル) - 2 - アミノ - 1 - メチルアミノ - 2 - メチル - プロ

パン

これは、実施例 18 と同様にして 2 - アミノ - 1 - メチルアミノ - 2 - メチル - プロパンおよびウンデシレン塩クロリドから得た（油）。収率 37%； $n_D^{25} 1.4795$ 。

分析： $C_{10}H_{16}N_2O_2$ (484.2)

計算値 C 74.7 H 11.6 N 6.4

測定値 C 75.0 H 11.5 N 6.4

実施例 87

N, N' - ピス - (10 - ウンデセノイル) - 2 - アミノ - 1 - (カ - ベンチルアミノ) - 2 - メチル - プ

ロパン

これは、実施例 18 と同様にして、2 - アミノ - 1 - (カ - ベンチルアミノ) - 2 - メチル - プロパンおよびウンデシレン塩から得た（油）。

収率 42%； $n_D^{25} 1.4780$ 。

分析：

計算値 N 5.7

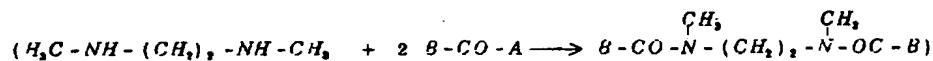
測定値 N 5.5

実施例 88-121 (第 7 頁)

カ 7 表中に示す化合物は、実施例 8 と同様にして、表中に記載する塩クロリドを 4.4 g (0.05 モル) の N, N' -ジメチルエチレン - ジアミン

(実施形態A.)と反応せしめることによつて、または実施例12と同様にして、表中に記載するカルボン酸系4.4% (0.05モル)のN,N'-ジメチルエチレンジアミン(実施形態B)と反応せしめることによつて、の何れかで合成した。

第7表：カルボン酸またはカルボン酸導体のN,N'-ジメチルエチレンジアミンとの反応



実験例	カルボン酸または カルボン酸導体 (B-CO-A)	実施形態	收率 (%)	融点 (再結晶溶剤)	経験式 (分子量)	分 析
88	$H_3C-(CH_2)_2-CO-Cl$	A	88	油; n_D^{25} 1.4695	$C_{12}H_{14}N_2O_2$ (228.2)	計算値 測定値 $C\ 63.2\ H\ 10.5\ N\ 12.8$ $C\ 63.4\ H\ 10.7\ N\ 12.4$
89	$(H_3C)_2CH-CH_2-CO-Cl$	A	79.5	油; n_D^{25} 1.4677	$C_{14}H_{20}N_2O_2$ (256.3)	計算値 測定値 $C\ 65.7\ H\ 11.0\ N\ 11.1$ $C\ 65.4\ H\ 10.8\ N\ 11.1$
90	$H_3C-(CH_2)_4-CO-Cl$	A	81	油; n_D^{25} 1.4678	$C_{16}H_{32}N_2O_2$ (284.8)	計算値 測定値 $N\ 9.8$ $N\ 9.4$
91	$H_3C-(CH_2)_5-CO-Cl$	A	78	油; n_D^{25} 1.4710	$C_{18}H_{38}N_2O_2$ (312.4)	計算値 測定値 $C\ 69.2\ H\ 11.6\ N\ 9.0$ $C\ 69.6\ H\ 11.6\ N\ 8.5$
92	$H_3C-(CH_2)_6-CO-Cl$	A	69.5	油; n_D^{25} 1.4711	$C_{20}H_{46}N_2O_2$ (340.5)	計算値 測定値 $C\ 70.6\ H\ 11.8\ N\ 8.2$ $C\ 70.8\ H\ 11.8\ N\ 8.8$
93	$H_3C-(CH_2)_7-CO-Cl$	A	76	87-88° (石油エーテル)	$C_{22}H_{54}N_2O_2$ (396.5)	計算値 測定値 $C\ 72.7\ H\ 12.2\ N\ 7.0$ $C\ 72.6\ H\ 12.2\ N\ 6.6$

表 7 表 (続1)

94	$H_3C - (CH_2)_3 - CO - Cl$	A	56	56° (リグロイン)	$C_{10}H_{20}N_2O_2$ (424.6)	計算値 測定値	N6.6 N6.8
95	$H_3C - (CH_2)_3 - CO - Cl$	A	70	54° (酢酸エチル)	$C_{10}H_{20}N_2O_2$ (452.8)	計算値 測定値	C7.4.2 H12.4 N6.2 C7.4.4 H12.1 N5.8
96	$(H_3C - CH_2 - CH_3)_2 - CH - CO - Cl$	A	74	油: n_D^{25} 1.4589	$C_{10}H_{20}N_2O_2$ (840.5)	計算値 測定値	C7.0.6 H11.8 N8.2 C7.1.0 H12.1 N8.0
97	$H_3C - (CH_2)_2CH - CO - Cl$	A	68	油: n_D^{25} 1.4698	$C_{10}H_{20}N_2O_2$ (840.5)	計算値 測定値	N8.2 N8.0
98	 - CO - Cl	A	55	90 - 91° (リグロイン)	$C_{10}H_{20}N_2O_2$ (308.4)	計算値 測定値	C7.0.1 H10.4 N9.1 C7.0.0 H10.4 N8.6
99	$H_3C = CH - (CH_2)_3 - CO - Cl$	A	48	油: n_D^{25} 1.4902	$C_{10}H_{20}N_2O_2$ (280.8)	計算値 測定値	N10.0 N9.7
100	$H_3C - (CH=CH)_2 - CO - Cl$	A	85	120 - 121° (ベンゼン)	$C_{10}H_{20}N_2O_2$ (276.4)	計算値 測定値	C6.9.6 H8.7 N10.1 C6.9.6 H9.0 N10.8
101	$H_3C = CH - (CH_2)_3 - CO - Cl$	A	48	81 - 82° (石油エーテル)	$C_{10}H_{20}N_2O_2$ (420.5)	計算値 測定値	N6.6 N6.9
102	$CH_3 - CH - CH = CH - CO - Cl$ $(CH_2)_3 - CH_3$	A	82	油: n_D^{25} 1.4850	$C_{10}H_{20}N_2O_2$ (504.8)	計算値 測定値	C7.6.2 H12.1 N5.5 O6.4 C7.6.2 H12.0 N5.6 O6.4

表 7 表 (続2)

103	$Cl - (CH_2)_3 - CO - Cl$	A	80	油: n_D^{25} 1.4998	$C_{10}H_8Cl_2N_2O_2$ (297.2)	計算値 測定値	C4.8.6 H7.5 Cl23.8 N9.4 C4.8.6 H7.7 Cl23.5 N9.2
104	$Br - (CH_2)_4 - CO - OH$	B	45	90 - 92° (リグロイン/酢酸エチル 2:1)	$C_{10}H_8Br_2N_2O_2$ (414.2)	計算値 測定値	Br3.8.6 N6.8 Br3.8.1 N6.7
105	$Br - (CH_2)_3 - CO - OH$	B	41	108 - 109° (アセトニトリル)	$C_{10}H_8Br_2N_2O_2$ (584.6)	計算値 測定値	C5.3.5 H8.9 Br27.4 N4.8 C5.3.9 H8.6 Br27.8 N4.8
106	$Br - CH_2CHBr - (CH_2)_3COOH$	B	27	油: n_D^{25} 1.5122	$C_{10}H_8Br_2N_2O_2$ (740.5)	計算値 測定値	Br4.3.8 N3.7 Br4.3.0 N3.8
107	$NC - (CH_2)_4 - CO - OH$	A	48	118 - 121° (トルエン)	$C_{10}H_{12}N_2O_2$ (306.4)	計算値 測定値	C6.2.7 H8.5 N18.8 C6.2.5 H8.8 N18.8
108	$H_3C - O - CH_2 - CO - Cl$	A	69.5	油: 沸点155°/0.1mm n_D^{20} 1.4758	$C_{10}H_{20}N_2O_4$ (260.8)	計算値 測定値	N10.7 N10.4
109	$S - (CH_2)_3 - CO - OH$ $(CH_2)_3 - CH_3$	B	59.2	油: n_D^{25} 1.5124°	$C_{10}H_{20}N_2O_4S_2$ (404.7)	計算値 測定値	C5.9.5 H9.9 N6.9 C5.9.4 H9.6 N6.5
110	$SO - (CH_2)_3 - CO - OH$ $(CH_2)_3 - CH_3$	B	62	102° (酢酸エチル)	$C_{10}H_{20}N_2O_4S_2$ (486.7)	計算値 測定値	C5.5.0 H9.2 N6.4 C5.4.7 H9.4 N6.8

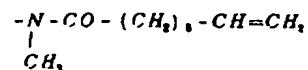
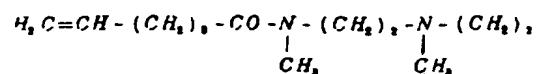
第 7 表 (続 3)

111	<chem>SO2-(CH2)3-CO-OH</chem> <chem>(CH2)3-CH3</chem>	B	52	117° (エタノール)	<chem>C20H40N2O6S</chem> (468.7)	計算値 測定値	N6.0 N6.4	S13.7 S13.8	
112	<chem>H3C-CO-(CH2)8-COOH</chem>	B	82	油: n_D^{20} 1.4858	<chem>C16H30N2O6</chem> (284.4)	計算値 測定値	N9.8 N10.0		
113	<chem>c1ccccc1S-(CH2)3-COOH</chem>	B	66	油: n_D^{20} 1.3792	<chem>C16H30N2O6S2</chem> (444.7)	計算値 測定値	N6.8 N6.1	S14.4 S14.0	
114	<chem>c1ccccc1O-(CH2)3-COOH</chem>	B	52.8	72° (リグロイン)	<chem>C20H38N2O6</chem> (413.54)	計算値 測定値	N6.8 N6.5		
115	<chem>H3C-c1ccccc1S-(CH2)3COOH</chem>	B	86.5	54° (メタノール)	<chem>C20H38N2O6S2</chem> (472.7)	計算値 測定値	N5.9 N5.6	S13.5 S13.4	
116	<chem>Cl-c1ccccc1S-(CH2)3COOH</chem>	B	88	92° (酢酸エチル)	<chem>C20H38ClN2O6S2</chem>	計算値 測定値	Cl 13.8 Cl 13.5	N5.5 N5.4	S12.5 S12.8
117	<chem>H3C-c1ccccc1O-(CH2)3COOH</chem>	B	40	60° (リグロイン)	<chem>C20H38N2O6</chem>	計算値 測定値	N6.4 N6.5		

第 7 表 (続 4)

118	<chem>c1ccccc1O-(CH2)4-COOH</chem>	B	52	油: n_D^{20} 1.3526	<chem>C20H38N2O6</chem> (440.6)	計算値 測定値	N70.8 N70.6	H8.8 H8.8	N6.4 N6.1	
119	<chem>H3C-CO-O-(CH2)10-CO-OH</chem>	B	41	48° (リグロイン)	<chem>C30H58N2O6</chem> (540.7)	計算値 測定値	C66.7 C66.5	H10.5 H10.4	N5.2 N4.8	O17.8 O17.4
120	<chem>c1ccccc1CH2-CO-Cl</chem>	A	50	油: n_D^{21} 1.5660	<chem>C20H34N2O2</chem> (324.4)	計算値 測定値	C74.0 C73.7	H7.5 H7.5	N8.6 N8.2	
121	<chem>H3C-C(=C)-(CH2)7-CO-Cl</chem>	A	62	48 - 50°	<chem>C20H44N2O2</chem> (416.7)	計算値 測定値	C75.0 C74.8	H10.6 H10.6	N6.7 N6.6	

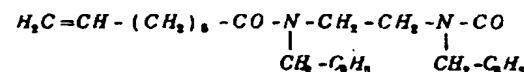
デセノイル-N-メチルアミノ)-エタン]



実施例 122

 N, N' -ジベンジル-N, N'-ビス-[10]

-クンデセノイル)-エチレンジアミン



これは、実施例 18 と同様にして、 N, N' -ジベンジル-エチレンジアミンおよびウンデシレン酸から取得することができた。収率：6.8%；
沸点 55~56°C (石油エーテル)。

分析：

計算値 C 79.8 H 9.8 N 4.9

測定値 C 79.6 H 9.9 N 4.9

実施例 123

 N -メチル-N, N-ビス-[2-(10-ウン

これは、実施例 16 と同様にして、無水テトラヒドロフラン中の 7.8 g (0.05 モル) の N, N' -トリメチル-ジエチレントリアミンを用いて調製した。生成する油状物を中性の液化アルミニウム上でクロマトグラフィーにかけた。溶離剤としては石油エーテルを用いた。収量：13.0 g (54.7%)；nD₂₀ 1.4798。

分析： $C_{20}H_{38}N_2O_2$ (477.7)

計算値 N 8.8 O 6.7

測定値 N' 8.8 O 6.7

実施例 124~128 (第 8 表)

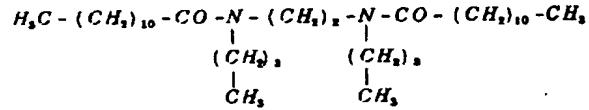
実施例 118~117 の合成は、実施例 16 と同様にして、0.1 モルのカルボン酸、10.1 g (0.1 モル) のトリエチルアミン、10.8 g (0.1 モル) のクロロギ酸エチルエステルおよび 5.8 g (0.05 モル) の N, N' -ジエチルエチレンジアミンを、無水テトラヒドロフラン中で反応せしめることにより行なつた。後処理後に取得した油状物を液化アルミニウム上でクロマトグラフィーにかけた。溶離剤としては石油エーテルを使用した。

第8表：カルボン酸のN,N'-ジエチルエチレンジアミンとの反応



実施例	カルボン酸 (B-COOH)	収量	屈折率	経験式 (分子量)	分析
124	$H_3C-(CH_2)_8-COOH$	1.29 (5.8%)	n_D^{25} 1.4655	$C_{28}H_{40}N_2O_2$ (452.7)	計算値 C 74.4 H 12.4 N 6.2 測定値 C 74.7 H 12.8 N 6.8
125	$H_3C-(CH_2)_{10}-COOH$	1.109 (4.6%)	融点 48~45° (石油エーテル)	$C_{30}H_{42}N_2O_2$ (480.7)	計算値 C 75.0 H 12.5 N 5.8 測定値 C 75.2 H 12.5 N 5.1
126	$H_3C=CH-(CH_2)_8-COOH$	1.09 (4.48%)	n_D^{20} 1.4772	$C_{28}H_{38}N_2O_2$ (453.7)	計算値 N 6.1 O 7.0 測定値 N 5.8 O 6.8
127	$H_3C-(CH_2)_8-COOH$	1.09 (4.8%)	n_D^{20} 1.4668	$C_{28}H_{40}N_2O_2$ (414.7)	計算値 C 73.6 H 12.8 N 6.6 O 7.5 測定値 C 73.8 H 12.8 N 6.8 O 7.4
128	$H_3C-(CH_2)_{12}-COOH$	1.059 (8.0%)	融点 44° (石油エーテル)	$C_{44}H_{60}N_2O_2$ (705.1)	計算値 N 4.0 測定値 N 4.2

実施例 129

N,N'-ビス-(ドデカノイル)-N,N'ジ-(n-ブチル)-エチレンジアミン

これは、実施例16に対して配したようにして、無水テトラヒドロフラン中の2.09(0.1モル)のドデカン酸、1.0.19(0.1モル)のトリエチルアミン、1.0.89(0.1モル)のクロロギ酸エチルエステルおよび8.69(0.05モル)のN,N'-ジ-n-ブチルエチレンジアミンから調整した。

中性の塩化アルミニウム上のクロマトグラフィーは、1.89(5.0%)の油、 n_D^{25} 1.4676を

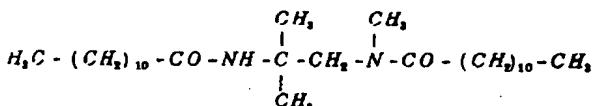
えた。

分析： $C_{34}H_{48}N_2O_2$ (586.8)

計算値 C 76.2 H 12.7 N 5.2

測定値 C 75.7 H 12.7 N 5.2

実施例 130

N,N'-ビス-(ドデカノイル)-2-アミノ-1-メチルアミノ-2-メチルプロパン

これは、実施例18と同様にして、テトラヒドロフラン中のドデカン酸クロリドおよび2-アミノ-1-メチルアミノ-2-メチルプロパンから合成した。生成する油は、塩基性強化アルミニウム上のクロマトグラフィーによつて精製することが可能であつた(ベンゼンによる溶出)。収量：

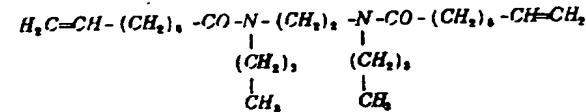
8.0 g (34.5%) : n_D^{25} 1.4718

分析:

計算値 C 74.6 H 12.5 N 6.0 O 6.8

測定値 C 74.4 H 12.7 N 6.0 O 6.9

実施例 181

N, N' - ピス - (10-ウンデセノイル) - N,N' - ジ - (n-ブチル) - エチレンジアミン

これは、18.4 g (0.1モル) のウンデシレン
を用いて、実施例 129 と同様にして、調製し
た。収量: 17.2 g の油状生成物 (68%) ;

 n_D^{25} 1.4738。分析: $C_{22}H_{38}N_2O_2$ (504.7)

計算値 N 5.5 O 6.8

測定値 N 5.2 O 6.5

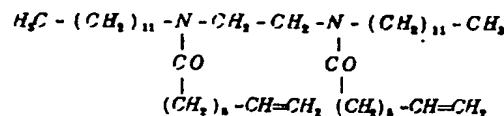
実施例 182~186 (第9表)

氷で冷却し且つ攪拌しながら、0.1モルの塩ク
ロリドを、8.6 g (0.05モル) の N, N' - ジ
- (第三-ブチル) - エチレンジアミン、10.1
g (0.1モル) のトリエチルアミンおよび200
mlの無水テトラヒドロフランから或る溶媒中に滴
下した。混合物を室温となるまで放置し且つ50
℃でさらに4時間加熱したのち、水中に注いだ。
沈殿した結晶を沪過し且つ再結晶した。

第9表：カルボン酸クロリド類と N, N' - ジ-第三-ブチル-エチレンジアミンとの反応

実施例	カルボン酸クロリド (B-CO-Cl)	収量	融点 (再結晶溶剤)	経験式 (分子量)	分析
182	$H_2C-(CH_2)_8-CO-Cl$	11.5 g (45.8%)	46~48° (石油エーテル)	$C_{20}H_{38}N_2O_2$ (508.8)	計算値 C 75.6 H 12.6 N 5.5 測定値 C 75.9 H 12.7 N 5.2
183	$H_2C=CH-(CH_2)_8-CO-Cl$	13.6 g (54%)	34° (石油エーテル)	$C_{20}H_{38}N_2O_2$ (504.9)	計算値 N 5.5 O 6.8 測定値 N 5.8 O 6.1
184	$H_2C_2-O-CO-(CH_2)_8-CO-Cl$	14 g (55%)	田; n_D^{25} 1.4787	$C_{22}H_{38}N_2O_4$ (512.7)	計算値 N 5.4 測定値 N 5.9
185	$\begin{matrix} C(CH_3)_3-CH_2-CO-Cl \\ CH_3-CO-OCH_3 \end{matrix}$	14.1 g (55%)	油; n_D^{25} 1.4758	$C_{20}H_{38}N_2O_4$ (512.7)	計算値 C 65.5 H 10.2 N 5.5 測定値 C 65.5 H 10.2 N 5.6
186	$H_2C-(CH_2)_{12}-CO-Cl$	15.2 g (51%)	55° (アセトニトリル)	$C_{28}H_{50}N_2O_2$ (595.1)	計算値 C 76.8 H 13.2 N 4.7 測定値 C 76.8 H 12.9 N 4.8

実施例 187



今度は、実施例 16 と同様にして、無水テトラヒドロフラン中の 19.8 g (0.05 モル) の N, N' - ドデシル - エチレンジアミン、10.1 g (0.1 モル) のトリエチルアミン、10.8 g (0.1 モル) のクロロギ酸エチルエステルおよび 18.4 g (0.1 モル) のウンデシレン酸から行なつた。収量 15.9 g (41.8 %)、燃点 48~44° (アセトニトリルかおよびメタノールから)。

分析: $C_{48}H_{88}N_2O_2$ (729.2)

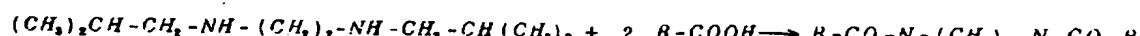
計算値 $C 79.2 \quad H 12.7 \quad N 3.8$

測定値 $C 79.8 \quad H 12.8 \quad N 3.6$

実施例 188~144 (第 10 表)

これらの化合物は、実施例 16 と同様にして、

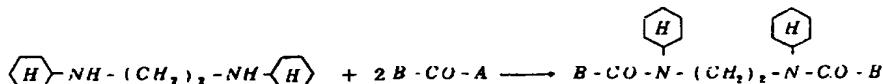
無水テトラヒドロフラン中の 0.1 モルのカルボン酸、10.1 g (0.1 モル) のトリエチルアミンおよび 10.8 g (0.1 モル) のクロロギ酸エチルエステルを、10.0 g (0.05 モル) の N, N' - ジイソバレリル - エチレンジアミンと反応せしめることによつて合成した。後処理後に収得した油は、中性の酸化アルミニウム上でクロマトグラフィーにかけた。溶離剤として石油エーテル (沸点 60~100°) を使用した。

第 10 表: カルボン酸類と N, N' - ジイソバレリル - エチレンジアミンとの反応

実施例	カルボン酸 (B-COOH)	収量	屈折率/ 燃点	経験式 (分子量)	分 析	
					計算値	測定値
188	$H_2C - (CH_2)_8 - CO - OH$	11.5 g (56.5%)	n_D^{20} 1.4631	$C_{32}H_{64}N_2O_2$ (508.8)	$C 75.6 \quad H 12.6 \quad N 5.5$	$C 75.5 \quad H 12.6 \quad N 5.1$
189	$H_2C - (CH_2)_9 - CO - OH$	15.0 g (58.6%)	n_D^{21} 1.4661	$C_{34}H_{68}N_2O_2$ (586.8)	計算値 測定値	$C 76.2 \quad H 12.7 \quad N 5.2$ $C 76.0 \quad H 12.6 \quad N 5.0$
140	$H_2C - (CH_2)_{10} - CO - OH$	13.8 g (24.5%)	n_D^{21} 1.4667	$C_{36}H_{72}N_2O_2$ (564.9)	計算値 測定値	$N 4.9 \quad O 5.6$ $N 4.9 \quad O 5.8$
141	$H_2C = CH - (CH_2)_2 - CO - OH$	16.0 g (60.8%)	n_D^{20} 1.4721	$C_{30}H_{64}N_2O_2$ (582.8)	計算値 測定値	$C 76.8 \quad H 12.1 \quad N 5.2$ $C 77.1 \quad H 11.9 \quad N 4.8$
142	$H_2C - (CH_2)_2 - CO - NH - (CH_2)_2 - CO - OH$	10.4 g (41.5%)	融点 99~91° (アセトニトリル)	$C_{28}H_{56}N_2O_4$ (510.7)	計算値 測定値	$N 10.9$ $N 11.0$
143	$H_2C_6 - CO - NH - (CH_2)_3 - CO - OH$	7.5 g (28%)	融点 99~101° (酢酸エチル)	$C_{34}H_{68}N_2O_4$ (578.6)	計算値 測定値	$N 9.6$ $N 9.4$
144	$I - (CH_2)_{10} - COOH$	17 g (44%)	$n_D^{22.0}$ 1.5058	$C_{36}H_{68}I_2N_2O_2$	計算値 測定値	$I 82.1 \quad N 3.5$ $I 82.0 \quad N 3.8$

実施例 145～154, 第11表

実施例 145～154は、12.2g (0.05モル) の N, N' -ジシクロヘキシル-エチレンジアミンを使用し、これを実施例 18 (実施形態A) と同様にして適当なカルボン酸と反応せしめることによつて、または実施例 16 (実施形態B) と同様にしてカルボン酸と反応せしめることによつて、行なつた。生成する油状物を、中性の液化アルミニウム上のクロマトグラフイーおよび石油エーテル (沸点 60～100°) による溶出によつて精製した。

第11表 カルボン酸またはカルボン酸クロリドと N, N' -ジシクロヘキシル-エチレンジアミンとの反応

実施例	カルボン酸または カルボン酸クロリド (B-CO-A)	実施 形態	収率 (%)	沸点 (再蒸留基準)	組成式 (分子量)	分 析
145	$H_2\text{C=CH}-(\text{CH}_2)_4-\text{CO-OH}$	B	11.5% (41.3%)	43～45° (石油エーテル)	$\text{C}_{10}\text{H}_{14}\text{N}_2\text{O}_2$ (556.9)	計算値 C 77.8 H 11.5 N 5.0 測定値 C 78.0 H 11.6 N 5.1
146	$H_3\text{C}-(\text{CH}_2)_8-\text{CO-Cl}$	A	18.1% (6.9%)	65° (リグロイン)	$\text{C}_{10}\text{H}_{16}\text{N}_2\text{O}_2$ (532.9)	計算値 C 76.6 H 12.1 N 5.2 測定値 C 76.6 H 12.4 N 5.0
147	$H_3\text{C}-(\text{CH}_2)_{12}-\text{CO-Cl}$	A	22.8% (70.8%)	77～78° (酢酸エチル)	$\text{C}_{16}\text{H}_{28}\text{N}_2\text{O}_2$ (645.1)	計算値 C 78.3 H 12.5 N 4.3 測定値 C 78.6 H 12.6 N 4.2 O 1.8
148	$(H_3\text{C}-\text{CH}_2)_2\text{CH}-\text{CO-Cl}$	A	18.4% (87.5%)	117° (リグロイン)	$\text{C}_{10}\text{H}_{16}\text{N}_2\text{O}_2$ (420.7)	計算値 N 6.7 測定値 N 6.8
149	$S-\text{CH}_2-\text{CO-Cl}$ $(\text{CH}_2)_7-\text{CH}_3$	A	18.6% (47%)	50° (石油エーテル)	$\text{C}_{11}\text{H}_{22}\text{N}_2\text{O}_2\text{S}_1$ (597.0)	計算値 N 4.6 S 1.0 測定値 N 4.4 S 1.0.8

第11表： 水

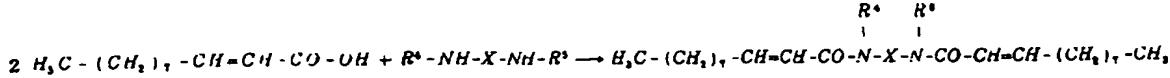
実施例	カルボン酸または カルボン酸クロリド (B-CO-A)	実験 品名 形態 (名)	融 点 (再結晶剤)	組成式 (分子量)	分 析	
					B	C
150	$\begin{array}{c} SO_2 - CH_2 - COOH \\ \\ (CH_2)_1 - CH_3 \end{array}$	B 19.2° (58%)	140° (メタノール)	$C_{14}H_{16}N_2O_6S_2$ (661.0)	計算値 C 61.8 H 9.8 N 4.2 4 S 9.7 測定値 C 61.5 H 10.1 N 4.5 S 9.8	
151	$\begin{array}{c} \text{C}_6\text{H}_5\text{CO} - (\text{CH}_2)_3 - \text{COOH} \end{array}$	B 11.8° (40.5%)	156-159° (エタノール)	$C_{19}H_{18}N_2O_2$ (572.8)	計算値 C 75.6 H 8.4 N 4.9 測定値 C 75.2 H 8.4 N 5.1	
152	$\begin{array}{c} (\text{H}_3\text{C})_2\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{S}-(\text{CH}_2)_3-\text{COOH} \end{array}$	B 16.2° (45%)	105-107° (リグロイン/ ベンゼン, 2:1)	$C_{24}H_{22}N_2O_2S_2$ (556.9)	計算値 C 73.7 H 9.7 N 3.7 3 S 8.5 8 測定値 C 73.4 H 9.7 N 3.8 S 8.6	
153	$\text{H}_3\text{C} - (\text{CH}_2)_3 - \text{CH}=\text{CH}-\text{COOH}$	B 34%	油 $n_D^{25} = 1.4874$	$C_{16}H_{18}N_2O_2$ (556.9)	計算値 N 5.0 測定値 N 4.8	
154	$\text{H}_3\text{C} - \text{CH}=\text{CH} - (\text{CH}_2)_3 - \text{COOH}$	B 44%	熔点 41° (石油エーテル)	$C_{16}H_{18}N_2O_2$ (556.9)	計算値 N 5.0 測定値 N 5.3	

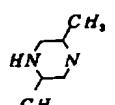
実施例 155~159

第12表中に示すこれらの化合物は、実施例

1.6記述した方法にてつて、18.4 g (0.1モル)
の2-クンデセン酸、10.1 g (0.1モル)のト
リエチルアミンおよび10.8 g (0.1モル)のク
ロロギ酸エチルエステルから、混合溶水物によつ
て、合成した。

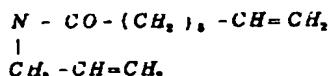
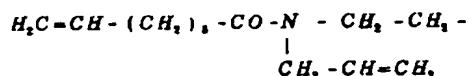
第12表 2-クンデセン酸とジアミンの反応



実験例	ジアミン $R^1-NH-X-NH-R^2$	吸量 (g)	沸点 (再結晶溶剤)	性状式 (分子量)	分析
155	$H_2N-(CH_2)_2-SO_2-(CH_2)_2-NH_2$	11.8 g (4.9%)	179-180° (エタノール)	$C_{10}H_{18}N_2O_2S$ (484.5)	計算値 C 64.5 H 10.0 N 5.8 S 6.6 測定値 C 64.6 H 9.8 N 5.5 S 6.7
156	$H_2N-(CH_2)_2-SO-(CH_2)_2-NH_2$	12.0 g (5.1%)	178-180° (エタノール)	$C_{10}H_{18}N_2O_2S$ (468.5)	計算値 C 66.6 H 10.3 N 5.9 S 6.8 測定値 C 66.3 H 10.2 N 5.9 S 6.9
157	$H_2N-(CH_2)_2-S-(CH_2)_2-NH_2$	8.2 g (3.6%)	122-124° (アセトニトリル)	$C_{10}H_{18}N_2O_2S$ (452.5)	計算値 N 8.2 S 7.1 測定値 N 8.0 S 7.1
158	$H_3C_6-N(CH_2-CH_2-NH_2)_2$	9.8 g (3.8%)	油; n_D^{25} 1.5228	$C_{10}H_{22}N_4O_2$ (511.7)	計算値 N 9.2 測定値 N 9.0
159		5 g (4.5%)	沸点 72-74° (酢酸エチル)	$C_{10}H_{18}N_2O_2$ (445.6)	計算値 6.2 測定値 6.5

実験例 160

N, N' -ビス-(10-ウンデセノイル)-N-
 N' -ジアリル-エチレンジアミン



10.8 g (0.1モル) のクロロギ酸エチルエス
テルを、-10°Cにおいて、約200 ml の無水テ
トラヒドロフラン中の18.4 g (0.1モル) のウ
ンデシレン酸および10.1 g (0.1モル) のトリ
エチルアミンから調製したトリエチルアンモニウ
ム塩に対して漏下した。この混合物を、さらに1
時間攪拌し、次いで60 ml の無水テトラヒドロフ
ラン中の7 g (0.05モル) の N, N' -ジアリ

ル-エチレンジアミンを漏下した。この混合物を
終夜室温に放置したのち、反応生成物を水で注
ぎ且つ150 ml のクロロホルムで3回抽出した。
クロロホルム溶液を水で洗い且つ乾燥するまで最
大限濃縮した。残留する油を中性の液化アルミニウム上
でクロマトグラフィーにかけた。これは9.5 g
(40.3%) の油を与えた; n_D^{21} 1.4839。

分析: $C_{10}H_{18}N_2O_2$ (472.7)

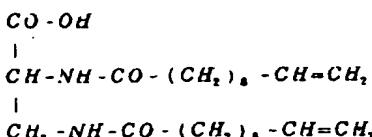
計算値 C 76.3 H 11.1 N 5.9 O 6.7

測定値 C 76.0 H 11.6 N 6.0 O 6.9

実験例 161

N, N' -ビス-(10-ウンデセノイル)-2-

3-ジアミノブロピオニ酸



20.2 g (0.1モル)のウンデシレン酸クロリドを、0℃において、74 (0.05モル)の2,3-ジアミノプロピオニ酸・HCl、20 g (0.5モル)のNaOH、100 mlの冰水、150 mlのベンゼンおよび50 mlのエーテルの混合物に對して滴下した。混合物を煮沸しながら、温までうちたたまるまで煮殺し、且つ半分濃縮して塩酸によつて生成としたのち、有機相を分離した。水洗後、乾燥するまで溶剤を除去し、生成物をアセトニトリルから再結晶した。

又量 6.3 g (29%)；熔点87~90°。

分析：C₁₁H₂₄N₂O₄ (436.5)

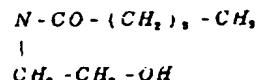
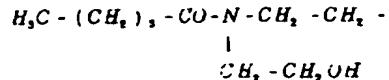
計算値 C 68.8 H 10.1 N 6.4

測定値 C 68.7 H 10.1 N 6.5

実験例 162

N, N'-ビス-(2-ヒドロキシエチル)-N,

N'-ビス-(ヘプタノイル)-エチレンジアミン



これは、実験例161と同様にして、n-ヘプタン酸およびN, N'-ビス-(2-ヒドロキシエチル)-エチレンジアミンから調製した。

又量 4.8 g；熔点96~99° (酢酸エチル/リグロイン、2:1)

分析：C₂₀H₄₀N₂O₄ (372.5)

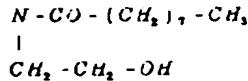
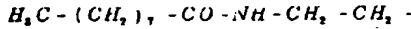
計算値 C 64.5 H 11.1 N 7.5

測定値 C 64.8 H 11.1 N 7.9

実験例 163

N-(2-ヒドロキシエチル)-N, N'-ビス

(ノナノイル)-エチレンジアミン



35 g (0.2モル)のペラルゴン酸クロリドを、0℃において、10.4 g (0.1モル)のN-(2-ヒドロキシエチル)-ジアミン、20.2 g (0.2モル)のトリエチルアミンおよび350 mlの無水クロロホルムの混合物に對して滴下した。この混合物を、さらに終末を半し、各層を分離し、有機相を水洗した。クロロホルムの留去後、

生成物をリグロインから再結晶した。

又量 15.3 g (40%)；熔点71~72°。

分析：C₂₂H₄₄N₂O₃ (384.4)

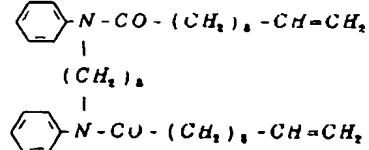
計算値 C 69.7 H 11.5 N 7.3 O 12.5

測定値 C 68.7 H 11.4 N 7.3 O 12.4

実験例 164

N, N'-ビス-(10-ウンデセノイル)-N,

N'-ジフェニルエチレンジアミン



この実験例の合成は、実験例12と同様にして、10.5 g (0.05モル)のN, N'-ジフェニルエチレンジアミンを反応せしめることにより行な

つ。

収量：8.7% (29.4%), 溶点 59~60° (アセトニトリルから)

分析：C₁₈H₂₂N₂O₂ (54.4.8)

計算値 C 79.5 H 9.6 N 5.1 O 5.8

測定値 C 79.7 H 9.7 N 4.8 O 5.7

実験例 165

N, N' - (p-トリルエニルアセチル) - ピペラジン



300 mlのキシレン中の30.0 g (0.2モル) の無水p-トリル酢酸および43.6 g (0.1モル) のビペラジンを、0.5リットルトルエンスルホン酸の添加後に、還原下にて水分確保の使用のうとで

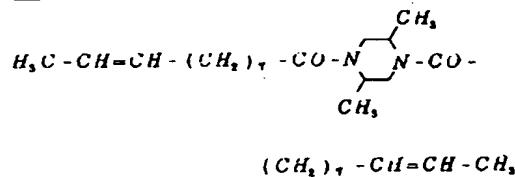
計算値 N 6.4

測定値 N 6.2

実験例 167

N, N' - ピス - (9 - ウンデセノイル) - 2 ,

5 - ジメチル - ピペラジン



これは、実験例 16 と同様にして、9 - ウンデセン酸およびビペラジンから取得することができた。

収率 54% ; 油, $\pi_{D}^{22.5}$ 1.4890

分析：C₂₈H₄₀N₂O₂ (446.7)

計算値 C 75.4 H 11.3 N 6.2

特開昭51-127002 (53)
加熱した。48時間後に混合物を含むし、析出した結晶を汎用し、トルエンから再结晶した。

収量：20.9 g (60%), 溶点 182°

分析：C₂₂H₃₆N₂O₂ (350.5)

計算値 C 75.5 H 7.49 N 8.0 O 9.15

測定値 C 75.5 H 7.7 N 7.6 O 9.2

実験例 166

N, N' - ピス - (5 - フェノキシベンタノイル) - ピペラジン



これは、実験例 16 と同様にして、5 - フェノキシベンタノイル酢酸およびビペラジンから合成した。

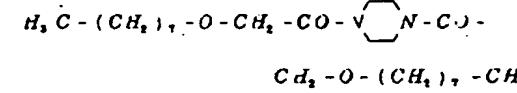
収率：46%; 溶点 88~91° (リグロイン)

分析：C₂₆H₃₄N₂O₄ (438.4)

測定値 C 75.2 H 11.3 N 6.3

実験例 168

N, N' - ピス - (オクチロキシアセチル) - ピペラジン



この物質は、実験例 16 と同様にして、オクチロキシアセチル酢酸およびビペラジンから取得した。

収率 72%; 溶点 37~38° (石油エーテル)

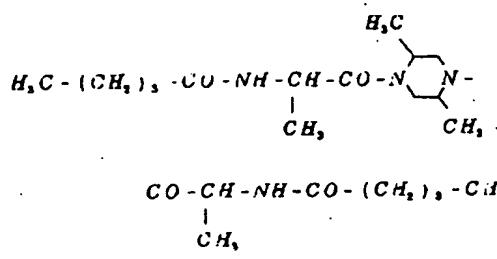
分析：C₂₄H₄₆N₂O₂ (426.6)

計算値 N 6.5

測定値 N 6.4

実験例 169

N, N' - ピス - (N - ペンタノイル - アラニル) - 2,5 - デジメチル - ピペラジン



又率 28%；極点 176~180°(准確エテル)

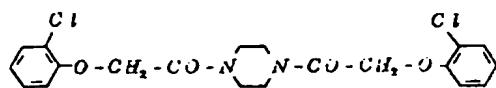
分析: $C_{2.2} H_{4.0} N_4 O_6$ (424.5)

針葉樹 N 1 3. 2

判定值 $N \geq 3.5$

寒 沸 例 170

N, N'-ビス-(2-クロロフェノキシアセチル)-ビペラジン



13表に示すジアミン類とが混せしめることによつて、行なつた。生成する油をカラムクロマトグラフィーによつて構成した（中性 41.0% 、石油エーテルによる溶出）。

特開昭51-127002(54)
これは、実例165と同様にして、8.69

(0.1モル)の無水ピペラシンおよび37.3g
(0.2モル)の2-クロロフェノキシン作用から合
成した。

度数：26.4°（62系）、触点23.4～

分析: C₂H₃Cl₂N₂O₄ (423.3)

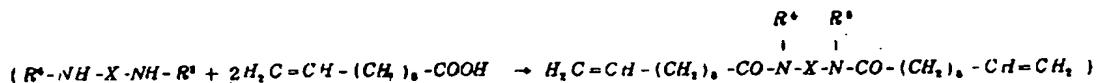
計量値 C t 1 6.8 N 6.6

测定值 Cl 16.7 N 6.4

寒 風 味 171~175, 第 13 表

実験例 132～136 は、実験例 16 と同様に
して、18.4 g (0.1 モル) のウンデシレン酸、
10.1 g (0.1 モル) のトリエチルアミンおよび
10.8 g (0.1 モル) のクロロギ酸エチルエステ
ルから得られた混合無水物を、0.05 モルの第

第13表： ウンデンレノ酸とジアミンの反応

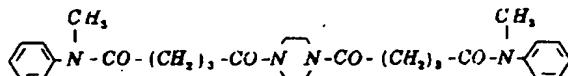


実施例	ジアミン (R ¹ -NH-X-NH-R ²)	収量 (再結晶率)	融点 (石油エーテル)	組成式 (分子量)	分析
1.7.1		14g (70%)	52-53°	C ₂ H ₆ N ₂ O ₂ (41.85)	計算値 N 6.7 測定値 N 6.4
1.7.2		7g (31.4%)	41-42°	C ₂ H ₆ N ₂ O ₂ (44.66)	計算値 N 6.2 O 7.2 測定値 N 6.2 O 6.9
1.7.3		12g (43.3%)	油: n _D ²¹ 1.4443	C ₂ H ₆ N ₂ O ₂ (56.48)	計算値 N 4.9 O 1.3 測定値 N 4.9 O 1.3
1.7.4		12g (38.3%)	油: n _D ²¹ 1.4722	C ₂ H ₆ N ₂ O ₂ (62.09)	計算値 C 73.6 H 1.6 N 4.5 測定値 C 73.4 H 1.1 N 4.5

第13表 続き

1.7.5		9g (35.4%)	油: n _D ²¹ 1.4839	C ₅ H ₁₀ N ₂ O ₂ (50.87)	計算値 C 70.9 H 1.1 N 5.5 O 1.2.5 測定値 C 71.1 H 1.0 N 5.5 O 1.2.3
1.7.6		10g (48%)	115-116 (エタノール/アセトニトリル)	C ₅ H ₁₀ N ₂ O ₂ (42.35)	計算値 C 71.0 H 1.1 N 6.6 測定値 C 71.1 H 1.3 N 6.3

実験例 177

N, N' - ピス - (4 - *N* - メチルアミニノカルボニルブチリルト - ピペラジン

300 ml のキシレンやの 4.9 g (0.025 モル)

のピペラジン・六水和物を、水分確鑿の使用下に、少量のヒートルエンスルホン酸の添加のもとで、1.1 g (0.05 モル) の 4 - *N* - メチルアミニノカルボニル溶液と共C、薄層クロマトグラフィーによつて出発材料がもはや認められなくなるまで (24 時間)、煮沸した。キシレンの挥发後、生成物をアセトニトリルから再結晶した。

収量: 3.1 g (41.5 %)、波数 142~143°

分析: C₂₁H₂₄N₂O₂ (492.6)

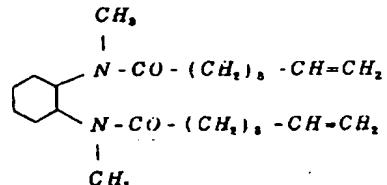
計算値 C 68.3 H 7.3 N 11.4

測定値 C 68.3 H 7.3 N 11.7

実験例 178

N, N' - ピス - (10 - ウンデセノイル) - 1 ,2 - (*N, N'* - ジメチルアミノ) - シクロヘキサ

-



18.4 g (0.1 モル) のウンデシレン酸、

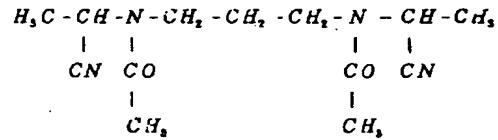
150 ml の無水テトラヒドロフランやの 7.1 g (0.05 モル) の 1, 2 - (*N, N'* - ジメチルアミノ) - シクロヘキサンやに加えた。100 ml の無水テトラヒドロフラン中の 21.4 g (0.1 モル) のジシクロヘキシルカルボジイミドを、30 分間にわかつて滴下した。この混合物をさらに絶夜煮沸したのち、ジシクロヘキシル溶液を沪過し、テトヒドロフランでよく洗つてから、溶剤を除去した。その残渣を中性の酸化アルミニウム上でクロマトグラフィーにかけた。溶媒剤として石油エーテルを用ひた。

収量: 3.6 g (15.2 %); π_D^{22} 1.4348
分析: C₂₀H₃₂N₂O₂ (474.8)

計算値 C 76.1 H 11.5 N 5.9 O 6.8

測定値 C 75.8 H 11.2 N 5.4 O 6.7

実験例 179

N, N' - ジアセチル - *N, N'* - ピス - (1 - シノエチル) - トリメチレンジアミン

9.0.0 g (0.5 モル) の *N, N'* - ピス - (1 - シアノエチル) - トリメチレンジアミンをエーテル中に溶解し且つ 11.2.2 g (1.1 モル) の無水酢酸を滴下した。終便放置後、オイルポンプを使用して揮発生成物を除去し、沾潤な残渣を中性の酸化アルミニウム上でクロマトグラフィーにかけた。溶媒剤として石油エーテル / 非溶エチル、1 : 1、を使用した。

油; π_D^{22} 1.4845分析: C₁₃H₂₀N₂O₂ (264.2)

計算値 N 21.2

測定値 N 19.8

出発物質として用いた N, N' -ビス-(1-シアノエチル)-トリメチレンジアミンは、次のようにして合成した：142 g (2モル) の乳酸ニトリルを、氷による冷却下に、200 ml のアルコール中の 74% の N, N' -ジアミノプロパンに對して滴下した。終後是洋したのち、溶剤を完全に除去した。後として油を吸収した。

分析: $C_9H_{18}N_2$ (180.2)

計算値 $N 30.5$

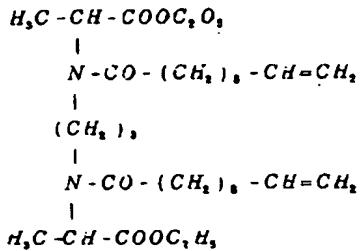
測定値 $N 30.6$

実 测 180

N, N' -ビス-(1-ウンデセノイル)- $N,$

N' -ビス-(1-エトキシカルボニルエチル)

-トリメチレンジアミン



合成は、実験例 16 と同様にして、18.4 g (0.1 モル) のウンデセノイル、10.1 g (0.1 モル) のトリエチルアミン、10.8 g (0.1 モル) のクロロギ酸エチルエステルおよび 13.7 g (0.05 モル) の N, N' -ビス-(1-エトキシカルボニルエチル)-トリメチレンジアミンから行なつた。生ずる粗生成物をクロマトグラフィー-(中性 Al_2O_3 ; 石油エーテルによる浴出) によつて精製した。

収量: 15.8 g (52.2%) の油状物；

η_D^{21} 1.4753

分析: $C_{13}H_{22}N_2O_2$ (606.7)

計算値 $N 4.6$

測定値 $N 4.7$

出発物質として使用した N, N' -ビス-(1-エトキシカルボニルエチル)-トリメチレンジアミンは、次のようにして合成した：36.0 g (2モル) の N, N' -ビス-(1-シアノエチル)-トリメチレンジアミンを、冷却および半下に、2.3 l の濃硫酸中に徐々に滴下した。次いで生成物を過硫酸下に 6 時間煮沸し、残渣が完全に乾くまで真液を真空中に除去し、残渣をメタノール中に取り、不溶物を汎別し、汎液を再び蒸発乾固した。残渣をメタノール中に取り、再び汎過したのち、汎液が僅かに塩基性反應を示すに至るま

で、その中にジエチルアミンを加えた。冷蔵庫中で放置(終夜)したのち、固体生成物を汎過し、アルコールでよく洗い且つ 70°C で乾燥した。

収量: 16.8 g (60%)； 沸点 > 250°。

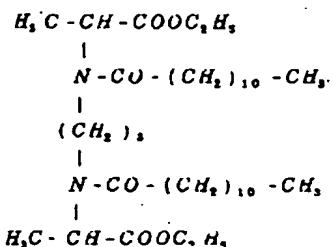
次いで溶てアミノ酸を、1 l の水エタノール中に懸濁させた。15~20°において、 HCl ガスを、過硫酸が泡立するまで通じた。終後真液、溶剤を真空中に除去し、残渣を 300 ml の氷水中に溶解し且つ 80 ml のエーテルを加えた。毛細管、浓度 30% の $NaOH$ 水溶液によってアルカリ性にならしめつつ、冷却によって温度を約 0°C に保つと、半固体の水相が生ずるまで固体 CO_2 を加えたのち、エーテル溶液を噴霧し、水相を 200 ml のエーテルによってさらに 3 回処理し、エーテル浴液を併せ、 Na_2SO_4 によって

よく乾燥したのち、蒸留した。沸点 128～
 132° / 0.6 mm；収量：79 g (37.4%)。
 分析：C₁₃H₂₀N₂O₄ (274.4)

計算値 C 56.9 H 9.6 N 10.2
 測定値 C 56.7 H 9.7 N 10.3

実験例 181

N, N'-ビス-(ドデカノイル)-N, N'-
ビス-(1-エトキシカルボニルエチル)-トリ
メチレンジアミン



これは実験例 16 および 180 と同様にして、

20.0 g (0.1 モル) のドデカン酸を用いて合成

した。

収量：48 g (0.1 モル)；油，n_D²¹ 1.4700

分析：C₂₂H₄₀N₂O₄ (568.7)

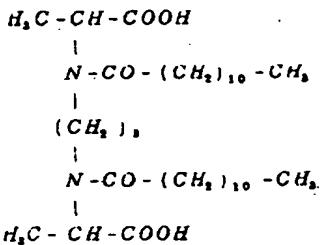
計算値 C 69.2 H 10.9 N 4.5 O 15.4

測定値 C 69.6 H 10.6 N 4.7 O 15.4

実験例 182

N, N'-ビス-(ドデカノイル)-N, N'-
ビス-(1-ヒドロキシカルボニルエチル)-ト

リメチレンジアミン



48.2 g (0.22 モル) のドデカン酸クロリドを、室～0° 気において、21.8 g (0.1 モル) の N, N'-ビス-(1-ヒドロキシカルボニルエチル)-トリメチレンジアミン(実験例 149 参照)、250 mL の 1NNaOH 水溶液、200 mL のエーテルから減る水で切し且つよく乾燥した、混合物中に漏下した。被液を水、油分を吸収とし、有機相を分離し水で洗つをのち、溶剤を留去し、油状の残渣をメタノールから再結晶した。

収量：41.2 g (72.5%)、沸点 36～38°

分析：C₂₂H₄₀N₂O₄ (568.7)

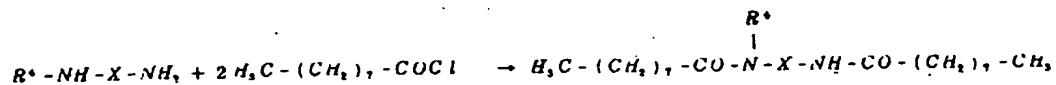
計算値 N 4.9

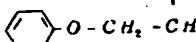
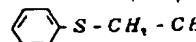
測定値 N 4.5

実験例 183～184、第 14 頁

これらの化合物は、実験例 18 と同様にして、0.05 モルの適当なアミンを、溶剤としてのクロロホルム中 0°C、17.7 g (0.1 モル) のノナン酸クロリドと反応させることによつて合成した。

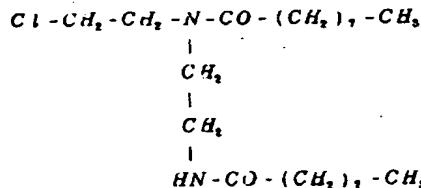
第14表：ジアミンとノナン酸クロリドとの反応



実験例	ジアミン ($R^{\bullet}-NH-X-NH_2$)	収量 (%)	融点 (再結晶溶剤)	組成式 (分子量)	分析
183	$H_2N-CH_2-CH_2-NH$ 	11g (48%)	油 $n_D^{22} : 1.4692$	$C_{12}H_{14}N_2O_2$ (460.7)	計算値 N 6.1 S 7.0 測定値 N 6.5 S 7.2
184	$H_2N-CH_2-CH_2-NH$ 	12.3g (56%)	油 $n_D^{20} : 1.4709$	$C_{11}H_{14}N_2O_2S$ (476.8)	計算値 N 5.9 S 7.5 測定値 N 6.1 S 7.4

実験例 185

$N-2-\alpha$ -クロロエチル- N, N' -ビス-(ノナノイル)-エチレンジアミン



9.8g (0.05モル) の $N-\beta$ -クロロエチル-エチレンジアミン・2HCl を、200mlの水水中に溶解した。水で冷却しながら、17.7g (0.11モル) のノナン酸クロリドおよび2N NaOH 水溶液を、約0°Cにおいて、溶液が均一性に保たれるような場合に、同時に滴下した。生成物を粗品において、さらに終点処理したのち、反応生成物をクロロホルムによつて抽出した。水

洗し且つ溶剤を留去したのちに、14.6gの粗品ジアミドを取得した。

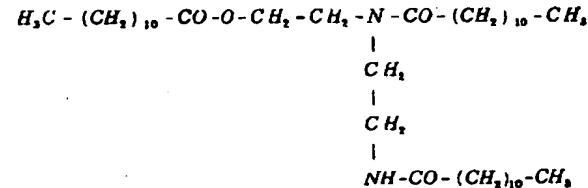
分析: $C_{12}H_{14}ClN_2O_2$ (403.06)

計算値 Cl 8.8 N 6.9

測定値 Cl 8.5 N 7.1

実験例 186

N, N' -ビス-(ドデカノイル)- $N-(\beta$ -ドデカノイロキシエチル)-エチレンジアミン



10.4g (0.1モル) - $N-(\beta$ -ヒドロキシエチル)-エチレンジアミンを、200mlの無水テトラヒドロフラン中に溶解した。30.3g (0.3

のトリエチルアミンの添加後に、46.9(0.3モル)/モル)のドデカン酸クロリドを、水で冷却しながら、滴下した。混合物を室温でさらに2時間搅拌したのち、それを約50°Cに2時間加温し、冷却し且つ水中に注いだ。反応生成物をクロロホルムで抽出した。水洗浄、乾燥するまで繰り返し、生成物をリグロインおよびアセトニトリルから再結晶した。

収量: 44.1g(68%)；融点62~64°

分析: C₄₀H₇₀N₂O₄(651.0)

計算値 C 73.8 H 12.1 N 4.3 O 9.8

測定値 C 73.6 H 12.6 N 4.1 O 9.5

実施例 187

ジエチル酢酸N,N'-ビス-(1,3-ジエチルセチルアミノ)-2-プロピルエステル

分析: C₂₁H₄₀N₂O₄(384.6)

計算値 C 65.6 H 10.5 N 7.3

測定値 C 65.6 H 10.7 N 7.0

実施例 188

N,N'-ビス-(β-ドデカノイル)-N,N'-ビス-(ドデカノイル)-エチレンジアミン

$$\begin{array}{c} H_3C - (CH_2)_{10} - CO - O - CH_2 - CH_2 - N - CO - (CH_2)_{10} - CH_3 \\ | \\ CH_2 \\ | \\ CH_2 \\ | \\ H_3C - (CH_2)_{10} - CO - O - CH_2 - CH_2 - N - CO - (CH_2)_{10} - CH_3 \end{array}$$

7.4g(0.05モル)のN,N'-ジ-(β-ヒドロキシエチル)-エチレンジアミンを200mlの水水中に溶解した。300mlのクロロホルムの添加後に、20g(0.25モル)の水酸化ナト

特開昭51-127002 (60)

$$\begin{array}{c} CH_3 - NH - CO - CH(C_2H_5)_2 \\ | \\ CH - O - CO - CH(C_2H_5)_2 \\ | \\ CH_3 - NH - CO - CH(C_2H_5)_2 \end{array}$$

22.2g(0.165モル)のジエチル酢酸クロリドを、100mlの無水クロロホルム中の4.5g(0.05モル)の1,3-ジアミノ-2-ヒドロキシ-ブロバンおよび16.7g(0.165モル)のトリエチルアミンに対して、水で冷却しながら、滴下した。この混合物を室温においてさらに2時間搅拌し、次いで約40°においてさらに2時間搅拌した。冷却後、これを順次、水、1NNaOH水溶液および水で洗浄した。クロロホルムの留去後で、生成物をリグロインから2回再結晶した。

収量: 12.6g(66%)；融点114~115°

リウムを加え、よく攪拌しながら、44g(0.2モル)のドデカン酸クロリドを0°Cにおいて滴下した。混合物を、冰浴の温度において、さらに3時間搅拌し、且つ終夜搅拌したのち、有機相を分離し且つ水で洗い、クロロホルムを真空中で留去した。残渣を、エタノールかメタノールから再結晶した。

収量: 43.8g(6.2%)；融点69~71°

分析: C₄₄H₈₀N₂O₄(877.4)

計算値 C 74.0 H 12.0 N 3.2

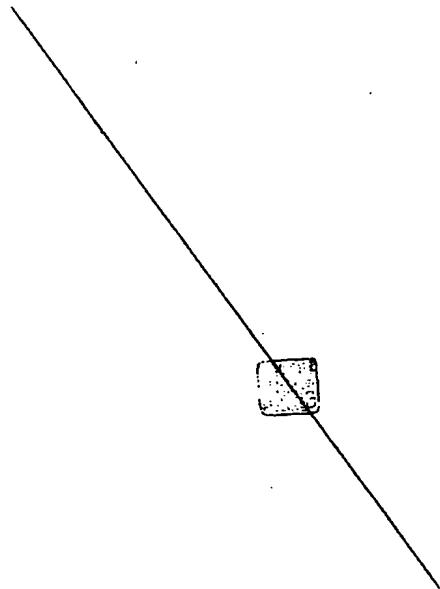
測定値 C 74.3 H 12.1 N 3.0

実施例 189~193

これらの実施例の合成は、実施例16と同様にして、容剤としてのテトラヒドロフラン中で、18.4g(0.1モル)のウンデシレン酸と0.05

モルの量中に記載のジアミノ化合物および混合物

水物を極端に反応によって行なつた。

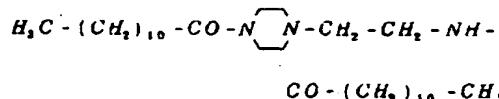


第15表：複素環式ジアミノ化合物とウンデシレン酸の反応

実験例 (R ⁴ -NH-X-NH-R ⁵)	ジアミノ化合物 (R ⁴ -NH-X-NH-R ⁵)	収量 (%)	融点 (再結晶溶剤)	総 構 式 (分子式)		分 析
				R ⁴	R ⁵	
189		17.8%	72 - 74° (リグロイン)	C ₈ H ₁₆ N ₂ O ₂ (46.17)	計算値 C 7.2 H 1.1.2 N 9.1 測定値 C 7.3 H 1.1.5 N 9.0	
190		11%	53° (石油エーテル)	C ₁₁ H ₁₈ N ₂ O ₂ (43.26)	計算値 C 7.5.0 H 1.1.1 N 6.5 O 7.4 測定値 C 7.5.2 H 1.1.0 N 6.3 O 7.5	
191		11.3%	41 - 42° (石油エーテル)	C ₁₂ H ₂₀ N ₂ O ₂ (44.67)	計算値 N 6.3 O 7.2 測定値 N 6.3 O 7.3	
192		9.5%	油 $n_D^{20} : 1.4893$	C ₁₃ H ₂₂ N ₂ O ₂ (46.07)	計算値 C 7.5.6 H 1.1.3 N 6.1 O 6.95 測定値 C 7.5.8 H 1.1.3 N 5.6 O 6.5	
193		11.3%	油 $n_D^{20} : 1.4862$	C ₁₄ H ₂₄ N ₂ O ₂ (46.07)	計算値 C 7.5.6 H 1.1.5 N 6.1 O 6.95 測定値 C 7.5.7 H 1.0.7 N 6.0 O 6.8	

実施例 194

N-ドデカノイル-*N'*-（ β -デカノイルアミノエチル）-ビペラジン



6.5 g (0.05モル)の*N*-（ β -アミノエチル）ビペラジンおよび1.01 g (0.1モル)のトリエチルアミンを、100 mlの無水クロロホルム中に溶解した。50 mlの無水*CHCl*₃中に溶解した21.8 g (0.1モル)のラウリン酸を滴下し、且つ混合物を室温において3時間、50℃において2時間攪拌した。次いで水と共に長ることによって油出し、クロロホルムを除去したのち、残渣をアルコールから再結晶した。

(リグロインから)

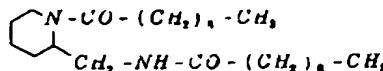
分析: C₂₀H₃₆N₂O₂ (408.5)

計算値 C 75.6 H 11.8 N 6.8 O 7.8

測定値 C 75.8 H 12.0 N 6.6 O 7.9

実施例 196

N,N'-ビス-（デカノイル）-2-アミノエチル-ビペリジン



この化合物は、実施例194と同様にして、5.7 g (0.05モル)の2-アミノメチル-ビペリジンおよび19.0 g (0.1モル)のデカン酸クロリドを用いて合成した。

収量: 9.2 g (43.6%), 溶点45~47°

(少量の石油エーテルから)

特開昭51-127002(62)
収量: 17.7 g (72%), 溶点87~88°

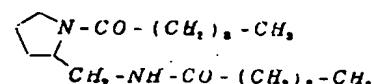
分析: C₂₀H₃₆N₂O₂ (493.7)

計算値 C 73.0 H 12.0 N 8.5 O 6.5

測定値 C 73.1 H 11.8 N 8.4 O 6.7

実施例 195

N,N'-ビス-（デカノイル）-2-アミノエチル-ビロリジン



この合成は、実施例194と同様にして行なつた。5 g (0.1モル)の2-アミノメチルビロリジンを19.0 g (0.1モル)のカプリリン酸クロリドと反応させた。

収量: 11.5 g (56.5%), 溶点55~56°

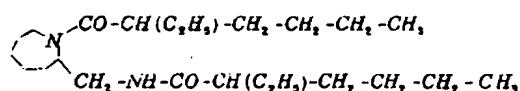
分析: C₂₀H₃₆N₂O₂ (422.6)

計算値 N 6.6 O 7.6

測定値 N 6.3 O 7.1

実施例 197

N,N'-ビス-（2-エチル-ヘキサノイル）-2-アミノメチル-ヘキサメチレンアミン



これは、実施例194と同様にして、6.4 g (0.05モル)の2-アミノメチル-シクロヘキサンアミンおよび16.2 g (0.1モル)のエチル-ブロビル-能親クロリドから合成した。中性の液化アルミニウム上でクロマトグラフィーおよび石油エーテルによる溶出後で、油状物を得た。

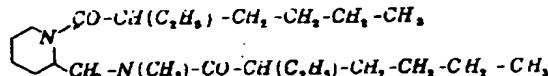
収量: 9.3 g (52.8%); n_D^{20} 1.4840

分析: C₁₃H₁₄N₂O₂ (380.6)

計算値 C 72.7 H 11.6 N 7.3

測定値 C 72.4 H 11.6 N 7.3

発明例 198

N, N' - ビス - (2 - エチル - ヘキサノイル)- 2 - メチルアミノメチル - ピペリジン

これは、発明例 194 と同様にして、クロロプロム中の 3.4 g (0.026 モル) の 2 - エチルアミノ - エチル - ピペリジン、5.3 g (0.052 モル) のトリエチルアミンおよび 8.4 g (0.052 モル) の 2 - エチルベンタン液クロリドから出発して合成した。中性 Al₂O₃ 上のクロマトグラフィーおよび石油エーテルによる層析にて、油状物

を得た。

又重: 4.5 g (53%)、n_D²¹ 1.4810分析: C₁₃H₁₄N₂O₂ (380.6)

計算値 C 72.7 H 11.6 N 7.3

測定値 C 72.6 H 11.8 N 7.6

特許出願人 バイエル・アクチエンゲゼルシャフト

代理人 弁護士 小田島 平吉

6. 添付書類の目録

(1) 明細書	1通
（2）委任状及びその訳文	各1通
接収証書及びその訳文	各1通
国籍及び法人証明書並びにこれらの訳文	各1通
（3）優先権証明書及びその訳文	各2通

7. 前記以外の発明者、特許出願人または代理人

(1) 発明者

住所 ドイツ・カッセル・ブンベルタール 1・クランディウス
氏名 ベクト

住所 リュディグ・ジット

氏名

住所

氏名

住所

氏名

(2) 特許出願人

住所

名称

(氏名)

代表者

国籍

(3) 代理人

住所 東京都港区赤坂1丁目9番15号
日本自動車会館

氏名

序内整理番号 6664 43 7242 44

7248 43 6742 43 7169 44

7330 43 6532 44 7306 44

6956 43 7043 44 5921 44

6652 43 7169 44 7043 44

(52) 日本分類

A61K 31 21

A61K 31 275

A61K 31 395

16 C412

16 C64

16 C83

16 C61

16 C87

16 C86

16 D21

16 D44

16 E531

16 E331

16 E431.1

16 E462

30 H43

30 G126.2

序内整理番号

7043 44

7043 44

⑤2日本分類

30 G127

30 G128

⑤1 Int.CI²